

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19)世界知的所有権機関  
国際事務局



(43)国際公開日  
2002年7月11日 (11.07.2002)

PCT

(10)国際公開番号  
WO 02/053543 A1

(51)国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 213/82, 215/54, 221/04, 401/04, 401/12, 405/04, 409/04, 413/06, 413/12, 413/14, 417/12, 455/02, 455/06, 471/04, 491/052, A61K 31/4439, 31/4709, 31/473, 31/465, 31/4375, 31/435, 31/4545, 31/5377, 31/4725, 31/506, 31/496, 31/4433, 31/4436, A61P 43/00, 25/00, 25/04, 37/00, 29/00

4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 花崎 浩二 (HANASAKI,Kohji) [JP/JP]; 〒553-0002 大阪府 大阪市福島区 鶯洲 5丁目 12番 4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP).

(21)国際出願番号: PCT/JP01/11427

(74)代理人: 山内 秀晃, 外(YAMAUCHI,Hideaki et al.); 〒553-0002 大阪府 大阪市福島区 鶯洲 5丁目 12番 4号 塩野義製薬株式会社 知的財産部 Osaka (JP).

(22)国際出願日: 2001年12月26日 (26.12.2001)

(81)指定国(国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(25)国際出願の言語: 日本語

(26)国際公開の言語: 日本語

(30)優先権データ:  
特願 2000-400768  
2000年12月28日 (28.12.2000) JP

(84)指定国(広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71)出願人(米国を除く全ての指定国について): 塩野義製薬株式会社 (SHIONOGI & CO., LTD.) [JP/JP]; 〒541-0045 大阪府 大阪市中央区 道修町 3丁目 1番 8号 Osaka (JP).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

(72)発明者: および  
(75)発明者/出願人(米国についてのみ): 多田 幸男 (TADA,Yukio) [JP/JP]; 〒553-0002 大阪府 大阪市福島区 鶯洲 5丁目 12番 4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 井宗 康悦 (ISO,Yasuyoshi) [JP/JP]; 〒553-0002 大阪府 大阪市福島区 鶯洲 5丁目 12番

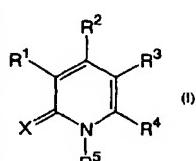
2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイドノート」を参照。

(54)Title: PYRIDONE DERIVATIVE HAVING AFFINITY FOR CANNABINOID 2-TYPE RECEPTOR

A1

(54)発明の名称: カンナビノイド2型受容体親和作用を有するピリドン誘導体

WO 02/053543



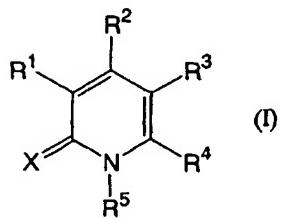
(57)Abstract: A compound having an affinity for a cannabinoid 2-type receptor. It is represented by the formula (I): (I) wherein R<sup>1</sup> represents a group represented by the formula -Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-Ra (wherein Y<sup>1</sup> is a single bond, etc.; Y<sup>2</sup> is -C(=O)-NH-, etc.; and Y<sup>3</sup> is optionally substituted aryl, etc.), etc.; R<sup>2</sup> represents hydrogen, etc.; R<sup>3</sup> represents alkyl, etc.; R<sup>4</sup> represents alkyl, etc.; and R<sup>5</sup> represents optionally substituted alkyl, etc.; provided that R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> may in combination represent a ring in cooperation with the adjacent atoms, etc.

[統葉有]



## (57) 要約:

カンナビノイド2型受容体親和性化合物として、式(I)：



(式中、R<sup>1</sup>は式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-Ra（式中、Y<sup>1</sup>は単結合等；Y<sup>2</sup>は-C(=O)-NH-等；Y<sup>3</sup>は置換されていてもよいアリール等）で示される基等；R<sup>2</sup>は水素等；R<sup>3</sup>はアルキル等；R<sup>4</sup>はアルキル等；R<sup>5</sup>は置換されていてもよいアルキル等；又はR<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は一緒になって、隣接する原子と共に環等）で示される化合物を見出した。

## 明細書

## カンナビノイド2型受容体親和作用を有するピリドン誘導体

## 5 技術分野

本発明は、ピリドン誘導体に関する。より詳しくは、カンナビノイド2型受容体親和性である医薬組成物（カンナビノイド2型受容体に対するアンタゴニスト作用又はアゴニスト作用を有するピリドン誘導体を含有する医薬組成物）に関する。

10

## 背景技術

カンナビノイドは、1960年にマリファナの活性物質の本体として発見され、その作用は、中枢神経系作用（幻覚、多幸感、時間空間感覚の混乱）、及び末梢細胞系作用（免疫抑制、抗炎症、鎮痛作用）であることが見出された。

15

その後、内在性カンナビノイド受容体アゴニストとして、アラキドン酸含有リン脂質から産生されるアンダミドや2-アラキドノイルグリセロールが発見された。これら内在性アゴニストは、中枢神経系作用及び末梢細胞系作用を発現することが知られているが、さらに、*Hypertension* (1997) 29, 1204-1210には、アンダミドの心血管への作用も報告されている。

20

カンナビノイド受容体としては、1990年にカンナビノイド1型受容体が発見され、脳などの中枢神経系に分布することがわかり、そのアゴニストは神経伝達物質の放出を抑制し、鎮痛作用や幻覚などの中枢作用を示すことがわかった。また、1993年にはカンナビノイド2型受容体が発見され、脾臓などの免疫系組織に分布することがわかり、そのアゴニストは免疫系細胞や炎症系細胞の活性化を抑制し、免疫抑制作用、抗炎症作用、鎮痛作用を示すことがわかった（*Nature*, 1993, 365, 61-65）。

従って、カンナビノイド2型受容体に対するアンタゴニスト又はアゴニストは、

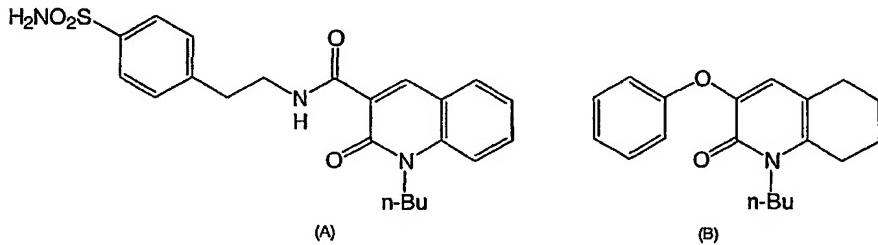
免疫抑制剤、抗炎症剤、鎮痛剤として期待されている（Nature, 1998, 349, 277-281）。

カンナビノイド2型受容体アンタゴニスト作用又はアゴニスト作用を有する化合物としては、WO 99/02499及びWO 00/40562にキノロン誘導体が記載されている。該キノロン誘導体は、以下に示すように、ベンゼン環部分がジアルコキシで置換されており、キノロンの窒素原子が水素又はメチルで置換された化合物である。



一方、ピリドン誘導体としては、EP 0481802及びJ. Med. Chem. 1998, 36, 953-066記載の抗HIV活性を有する化合物が挙げられる。

また以下の(A)に示すキノロン誘導体が、医薬の中間体として特開昭58-46068に記載されている。また、以下の(B)に示すピリドン誘導体が、J. Chem. Soc. Perkin. Trans. I (1984) p1173-1182に記載されている。



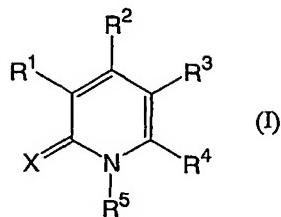
15

### 発明の開示

カンナビノイド2型受容体に対するアンタゴニスト作用又はアゴニスト作用を有する新規な化合物として、以下に説明するピリドン誘導体を見出した。

すなわち、本発明は、

20 (1) 式(I)：



(式中、R<sup>1</sup>は水素、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>及びY<sup>3</sup>はそれぞれ独立して単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり；Y<sup>2</sup>は単結合、-O-、-O-C(=O)-、-O-C(=O)-O-、-O-C(=O)-NR<sup>b</sup>-、-O-SO<sub>2</sub>-、-NR<sup>b</sup>-、-NR<sup>b</sup>-C(=O)-、-NR<sup>b</sup>-SO<sub>2</sub>-、-NR<sup>b</sup>-C(=NH)-、-NR<sup>b</sup>-C(=O)-O-、-NR<sup>b</sup>-C(=O)-NR<sup>b</sup>-、-NR<sup>b</sup>-C(=S)-、-NR<sup>b</sup>-C(=S)-NR<sup>b</sup>-、-NR<sup>b</sup>-SO<sub>2</sub>-NR<sup>b</sup>-、-NR<sup>b</sup>-C(=NH)-NR<sup>b</sup>-、-S-、-SO<sub>2</sub>-O-、-SO<sub>2</sub>-NR<sup>b</sup>-、-SO<sub>2</sub>-NR<sup>b</sup>-C(=O)-NR<sup>b</sup>-、-C(=O)-O-、-C(=O)-NR<sup>b</sup>-、-C(=O)-NR<sup>b</sup>-C(=S)-NR<sup>b</sup>-C(=O)-、-C(=S)-NR<sup>b</sup>-C(=O)-、-C(=NH)-NR<sup>b</sup>-、-C(=O)-、-C(=O)-NR<sup>b</sup>-C(=NR<sup>b</sup>)—又は-C(=O)-NR<sup>b</sup>-NR<sup>b</sup>—であり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基又はアシルであり；R<sup>b</sup>はそれぞれ独立して水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基、アシル、ヒドロキシ又はアルコキシである）で示される基であり；R<sup>2</sup>は水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、

置換されていてもよいアルキニル、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式： $-Y^4-R^{\circ}$ （式中、 $Y^4$ は単結合、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-C(=O)-NH-$ 又は $-NH-C(=O)-$ であり； $R^{\circ}$ は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基であり； $R^3$ 及び $R^4$ はそれぞれ独立して、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式： $-Y^5-R^d$ （式中、 $Y^5$ は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-C(=O)-NH-E$ 又は $-NH-C(=O)-$ であり； $E$ は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり； $R^d$ は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基であり； $R^5$ は水素、ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよいアルキル又は式： $-Y^6-R^{\circ}$ （式中、 $Y^6$ は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-NH-E$ 又は $-NH-C(=O)-$ であり； $E$ は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり； $R^e$ は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基であり；又は、 $R^2$ 及び $R^3$ の組合せ、 $R^3$ 及び $R^4$ の組合せ、 $R^4$ 及び $R^5$ の組合せ

のいずれか一つの組合わせが一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成していてもよく；

XはS又はOである；

5 但し、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共にアルコキシでジ置換されたベンゼン環を形成し、かつR<sup>5</sup>が水素又はメチルである場合を除く。)で示される化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物を有効成分として含有するカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

(2) R<sup>5</sup>がヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい炭素数2以上のアルキル又は式：—Y<sup>6</sup>—R<sup>o</sup>（式中、Y<sup>6</sup>及びR<sup>o</sup>は上記(1)と同意義である）で示される基である上記(1)記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

(3) R<sup>5</sup>がヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式：—Y<sup>6</sup>—R<sup>o</sup>（式中、Y<sup>6</sup>は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>o</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロサイクルである）で示される基である上記(2)記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

(4) R<sup>1</sup>が式：—Y<sup>1</sup>—Y<sup>2</sup>—Y<sup>3</sup>—R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Y<sup>3</sup>、R<sup>a</sup>及びR<sup>b</sup>は上記(1)と同意義である）で示される基である上記(1)～(3)のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

(5) R<sup>1</sup>が式：—Y<sup>1</sup>—Y<sup>2</sup>—Y<sup>3</sup>—R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>、Y<sup>3</sup>及びR<sup>a</sup>は上記(1)と同意義であり；Y<sup>2</sup>は—O—、—NR<sup>b</sup>—C(=O)—又は—C(=O)—NR<sup>b</sup>—であり；R<sup>b</sup>は水素又は置換されていてもよいアルキルである）で示される基である上記(4)記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

(6) R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になつてない上記(1)～(5)のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

(7)  $R^3$  が水素、置換されていてもよいアルキル、ハロゲン又は式： $-Y^5-R^d$  (式中、 $Y^5$  は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレンであり； $R^d$  は置換されていてもよいアリール又は置換されていてもよいヘテロアリールである) で示される基であり； $R^4$  が水素又は置換されていてもよいアルキルである（但し、 $R^3$  及び  $R^4$  が同時に水素である場合を除く。）上記

5 (6) 記載のカンナビノイド 2 型受容体親和性医薬組成物、

(8)  $R^3$  及び  $R^4$  が一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環（但し、置換されていてもよいベンゼン環でない）を形成する上記 (1) ~ (5) のいずれかに記載の  
10 カンナビノイド 2 型受容体親和性医薬組成物、

(9)  $R^1$  が水素、シアノ、ホルミル、カルボキシ、イソチオシアナト、アミノ、ヒドロキシ、カルバモイル又は式： $-Y^1-Y^2-Y^3-R^a$  (式中、 $Y^1$  及び  $Y^3$  はそれぞれ独立して単結合又は置換されていてもよいアルキレン（置換基としては、ハロゲン、アルケニレン、ヒドロキシ、アジド、アミノ、アシルアミノ、アルキルスルホニルアミノ、アルケニルオキシカルボニルアミノ、アルコキシカルボニルアミノ、アルケニルアミノ、アリールカルボニルアミノ、ヘテロアリールカルボニルアミノ、シアノ、アルコキシ、アルキルスルホニルオキシ、トリアルキルシリルオキシ、オキソ、メチレン、ハロゲン化アルコキシカルボニルオキシ、ホルミルオキシ及び／又はアシルチオ）であり； $Y^2$  は単結合、 $-O-$ 、 $-O-C(=O)-$ 、  
15  $-O-C(=O)-O-$ 、 $-O-C(=O)-NH-$ 、 $-NH-C(=O)-$ 、 $-NR^b-C(=O)-$ 、 $-NH-C(=O)-O-$ 、 $-NH-C(=O)-NH-$ 、 $-NH-C(=S)-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-O-$ 、 $-SO_2-NH-$ 、 $-SO_2-NH-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-O-$ 、 $-C(=O)-NR^b-$ 、  
20  $-C(=S)-NH-$ 、 $-C(=O)-NH-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-C(=O)-$ 、 $-NH-C(=S)-$ 、 $-C(=O)-NH-C(=O)-O-$ 、 $-C(=O)-NH-C(=O)-NR^b-$ 、 $-C(=S)-C(=O)-$ 、  
25  $-C(=O)-NH-C(=O)-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-NH-C(=O)-NR^b-$  又は  $-C(=O)-NH-NR^b-$  であり； $R^a$  が置換されていてもよいアルキル（置換基としては、ヒドロキシ及び／又はアラルキル）、アルケニル、置換さ

れていてもよいアリール（置換基としては、カルボキシ、置換されていてもよいアミノ、アルコキシ、アルキルチオ、アルキレンジオキシ、ハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン化アルキル及び／又はハロゲン化アルコキシ）、置換されていてもよいシクロアルキル（置換基としては、アリール及び／又はヒドロキシ）、  
 5 置換されていてもよいシクロアルケニル（置換基としては、アルケニレン、ヒドロキシ、アルキルスルホニルオキシ、アジド、アミノ及び／又はアシルアミノ）、置換されていてもよいヘテロアリール（置換基としては、オキソ、ヘテロアリール、ハロゲン、アリール及び／又はアルキル）又は置換されていてもよいヘテロサイクル（置換基としては、ハロゲンで置換されていてもよいアリール、アラル  
 10 キル、アシル、アリールカルボニル、シクロアルキルカルボニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アルキル及び／又はハロゲン化アルキルカルボニル）であり；R<sup>b</sup>が水素、アルキル、アシル、ヒドロキシ及び／又はアルコキシである）で示される基であり；  
 R<sup>2</sup>が水素、アルキル、アルケニル又は式：-Y<sup>4</sup>-R<sup>c</sup>（式中、Y<sup>4</sup>が-O-である；R<sup>c</sup>がヘテロアリールである）で示される基であり；  
 R<sup>3</sup>が水素、アルキル、ハロゲン又は式：-Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合、アルキニレン又は-C(=O)-NH-アルキレシーであり；R<sup>d</sup>は置換されていてもよいアリール（置換基としては、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ及び／又はハロゲン化アルキル）又は置換されていてもよいヘテロアリール（置換基としては、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ及び／又はハロゲン化アルキル）である）で示される基であり；  
 R<sup>4</sup>が水素、アルキル又は式：-Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合であり；R<sup>d</sup>はアリールである）で示される基であり；  
 R<sup>5</sup>が水素、ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル（置換基としては、ハロゲン、ヒドロキシ、アジド、アミノ、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキルスルホニルオキシ、アシルチオ、アシルアミノ、アリールカルボニルアミノ、シクロアルキルカルボニ  
 25

ルアミノ、ハロゲン化アルキルカルボニルアミノ、アルキルスルホニルアミノ、アリールスルホニルアミノ、ホルミル、オキソ及び／又はシアノ) 又は式：—Y<sup>6</sup>—R<sup>o</sup> (式中、Y<sup>6</sup>はアルキレンであり；R<sup>o</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロアリール又 5 は置換されていてもよいヘテロサイクルである) で示される基であり；

又は、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>が一緒になって、隣接する原子と共に置換されていてもよい炭素環 (置換基としては、オキソ及び／又はヒドロキシ) を形成するか、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在して 10 いてもよい置換されていてもよい環 (置換基としては、アシル、アラルキル、アルケニレン及び／又はアルキレン) を形成するか、又はR<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>が一緒になって、隣接する原子と共に不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい炭素環 (置換基としては、アルケニレン) を形成する上記 (1) 記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

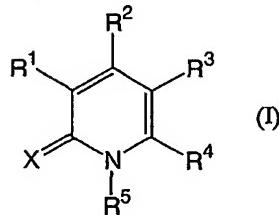
(10) 抗炎症剤である上記 (1) ~ (9) のいずれかに記載のカンナビノイ 15 ド2型受容体親和性医薬組成物、

(11) 免疫抑制剤である上記 (1) ~ (9) のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

(12) 腎炎治療剤である上記 (1) ~ (9) のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

20 (13) 鎮痛剤である上記 (1) ~ (9) のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

(14) 式 (I) :



(式中、R<sup>1</sup>は式：—Y<sup>1</sup>—Y<sup>2</sup>—Y<sup>3</sup>—R<sup>a</sup> (式中、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Y<sup>3</sup>及びR<sup>b</sup>は上

記（1）と同意義であり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基又はアシルである）で示される基であり；

R<sup>2</sup>は水素又は置換されていてもよいアルキルであり；

R<sup>3</sup>は置換されていてもよいアルキル、ハロゲン又は式：—Y<sup>5</sup>—R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>

5 は単結合又はアルキニレンであり；R<sup>d</sup>は上記（1）と同意義である）で示される基であり；

R<sup>4</sup>は水素又は置換されていてもよいアルキルであり；

R<sup>5</sup>はヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式：—Y<sup>6</sup>—R<sup>e</sup>（式中、Y<sup>6</sup>及びR<sup>e</sup>は上記（1）

10 と同意義である）で示される基であり；

又は、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい環を形成してもよく；

Xは上記（1）と同意義である；

但し、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共に置換されていてもよいベ

15 シゼン環を形成する場合は、R<sup>1</sup>が式：—Y<sup>1</sup>—Y<sup>2</sup>—Y<sup>3</sup>—R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>が単結合であり；Y<sup>3</sup>が置換されていてもよいアルキレンであり；Y<sup>2</sup>は—NR<sup>b</sup>—C(=O)—、—C(=O)—NR<sup>b</sup>—であり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基であり；R<sup>b</sup>は水素又は置換されていてもよいアルキルである。）で示される基である；

20 なお、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共に非置換炭素環（但し、R<sup>3</sup>が置換している炭素原子とR<sup>4</sup>が置換している炭素原子間の結合のみが二重結合であり、他の炭素原子間の結合は単結合である）を形成し、かつR<sup>1</sup>が式：—Y<sup>1</sup>—Y<sup>2</sup>—Y<sup>3</sup>—R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>及びY<sup>3</sup>が単結合であり；Y<sup>2</sup>が—O—であり；R<sup>a</sup>フェニルである）で示される基である場合及びR<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共にベンゼン環を形成し、かつR<sup>1</sup>が式：—Y<sup>1</sup>—Y<sup>2</sup>—Y<sup>3</sup>—R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>が単結合であり、Y<sup>3</sup>がエチレンであり、Y<sup>2</sup>が—C(=O)—NR<sup>b</sup>—であり、かつR<sup>a</sup>がスルファモイルで置換されたフェニルである）で示される基であ

る場合を除く。) で示される化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

(15)  $R^1$  が式 :  $-Y^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$  (式中、 $Y^1$ 、 $Y^3$  及び  $R^a$  は上記 (14) と同意義であり;  $Y^2$  は  $-O-$ 、 $-NR^b-C(=O)-$  又は  $-C(=O)-NR^b-$  であり;  $R^b$  は水素又は置換されていてもよいアルキルである) で示される基である上記 (14) 記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

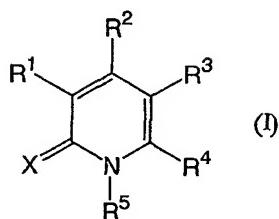
(16)  $R^3$  及び  $R^4$  が一緒になつてない上記 (14) 又は (15) 記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

(17)  $R^3$  及び  $R^4$  が一緒になつて、隣接する原子と共にヘテロ原子及び/又は不飽和結合が介在していてもよい環を形成する上記 (14) 又は (15) 記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

(18)  $R^1$  が式 :  $-Y^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$  (式中、 $Y^1$  は単結合であり;  $Y^3$  は置換されていてもよいアルキレンであり;  $Y^2$  は  $-O-$ 、 $-NH-C(=O)-$  又は  $-C(=O)-NH-$  であり;  $R^a$  は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である) で示される基であり;  $R^2$  が水素であり;  $R^3$  がアルキル、ハロゲン又は式 :  $-Y^5 - R^d$  (式中、 $Y^5$  は単結合であり;  $R^d$  は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である) で示される基であり;  $R^4$  が水素又はアルキルであり;  $R^5$  が置換されていてもよい炭素数 3 以上のアルキル又は式 :  $-Y^6 - R^e$  (式中、 $Y^6$  は置換されていてもよいアルキレンであり;  $R^e$  は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル又は置換されていてもよいヘテロアリールである) で示される基であり;

又は  $R^3$  及び  $R^4$  は一緒になつて、隣接する原子と共にヘテロ原子が介在していてもよい環を形成していてもよい上記 (14) 記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

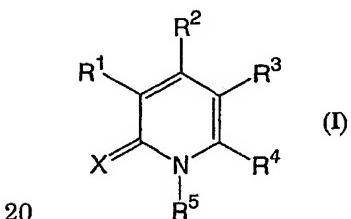
(19) 式 (I) :



(式中、R<sup>1</sup>は式： $-Y^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$ （式中、Y<sup>1</sup>は単結合であり；Y<sup>3</sup>は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり；Y<sup>2</sup>は $-C(=O)-NR^b-$ であり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基であり；R<sup>b</sup>は水素である）で示される基であり；R<sup>2</sup>は水素であり；R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は一緒になって、隣接する原子と共に炭素環（但し、R<sup>3</sup>が置換している炭素原子とR<sup>4</sup>が置換している炭素原子間の結合のみが二重結合であり、他の炭素原子間の結合は単結合である）を形成し；R<sup>5</sup>は炭素数3以上のアルキル又は式： $-Y^6 - R^e$ （式中、Y<sup>6</sup>は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>e</sup>は置換され  
5 ていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル又は置換されていてもよいヘテロアリールである）で示される基であり；XはS又はOである。）  
10 で示される化合物のライブラリー、

(20) 上記(19)記載の化合物（但し、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共に6員の炭素環（但し、R<sup>3</sup>が置換している炭素原子とR<sup>4</sup>が置換して  
15 いる炭素原子間の結合のみが二重結合であり、他の炭素原子間の結合は単結合である）を形成し、かつR<sup>1</sup>が式： $-Y^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$ （式中、Y<sup>1</sup>及びY<sup>3</sup>が単結合であり；Y<sup>2</sup>が $-O-$ であり；R<sup>a</sup>フェニルである）で示される基である場合を除く。）、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

(21) 式(I)：

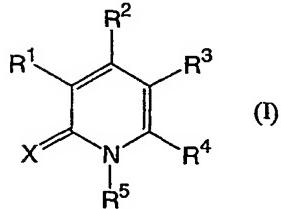


20 (式中、R<sup>1</sup>は式： $-Y^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$ （式中、Y<sup>1</sup>は単結合であり；Y<sup>2</sup>は $-$

C (=O) - N R<sup>b</sup> - であり；Y<sup>3</sup>は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基であり；R<sup>b</sup>は水素である）で示される基であり；R<sup>2</sup>は水素であり；R<sup>3</sup>は式：- Y<sup>5</sup> - R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合、R<sup>d</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基であり；R<sup>4</sup>は水素又はアルキルであり；R<sup>5</sup>は炭素数3以上のアルキル又は式：- Y<sup>6</sup> - R<sup>e</sup>（式中、Y<sup>6</sup>は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>e</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル又は置換されていてもよいヘテロアリールである）で示される基であり；XはS又はOである。）で示される化合物のライ  
10 ブラリー、

(22) 上記(21)記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

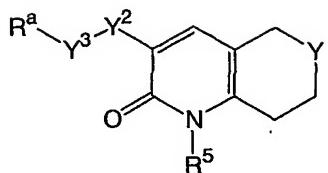
(23) 式(I)：



15 (式中、R<sup>1</sup>は式：- Y<sup>1</sup> - Y<sup>2</sup> - Y<sup>3</sup> - R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>及びY<sup>3</sup>は単結合であり；Y<sup>2</sup>は- N R<sup>b</sup> - C (=O) - であり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基であり；R<sup>b</sup>は水素である）で示される基であり；R<sup>2</sup>は水素であり；R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>はそれぞれ独立してアルキルであり；R<sup>5</sup>は炭素数3以上のアルキルで示される基であり；XはOである。）で示される化合物のライブラリー、

20 (24) 上記(23)記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

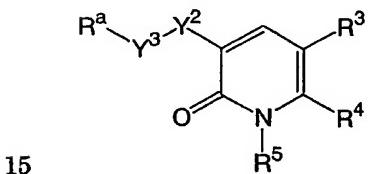
(25) 式：



(式中、Yは単結合、-NH-、-O-又は- $(\text{CH}_2)_{1-5}$ -であり、 $\text{Y}^2$ は-C(=O)-NH-又は-NH-C(=O)-であり、 $\text{Y}^3$ は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり、 $\text{R}^a$ は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロサイクルであり、 $\text{R}^5$ は置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式: $-\text{Y}^6-\text{R}^e$ （式中、 $\text{Y}^6$ はアルキレンであり； $\text{R}^e$ は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロサイクルである）で示される基である化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

(26) Yが- $(\text{CH}_2)_3$ -である上記(25)記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

(27) 式:



(式中、 $\text{R}^3$ 及び $\text{R}^4$ はそれぞれ独立してアルキルであり、 $\text{Y}^2$ は-C(=O)-NH-又は-NH-C(=O)-であり、 $\text{Y}^3$ は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり、 $\text{R}^a$ は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロサイクルであり、 $\text{R}^5$ は置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式: $-\text{Y}^6-\text{R}^e$ （式中、 $\text{Y}^6$ はアルキレンであり； $\text{R}^e$ は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロサイクルである）で示される基である化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

テロサイクルである)で示される基である化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

(28)  $\text{Y}^3$ が置換されていてもよいアルキレンである上記(25)～(27)のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

(29) 上記(14)～(18)、(20)、(22)、(24)～(28)のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有する医薬組成物、

(30) カンナビノイド2型受容体親和性である上記(29)記載の医薬組成物、

10 (31) 抗炎症剤である上記(29)記載の医薬組成物、

(32) 免疫抑制剤である上記(29)記載の医薬組成物、

(33) 腎炎治療剤である上記(29)記載の医薬組成物、

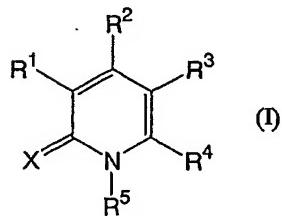
(34) 鎮痛剤である上記(29)記載の医薬組成物、

(35) 上記(1)～(13)のいずれかに記載の化合物を投与することを特徴とするカンナビノイド2型受容体に関連する疾患の治療方法、

15 (36) カンナビノイド2型受容体に関連する疾患の治療剤を製造するための上記(1)～(13)のいずれかに記載の化合物の使用、  
に関する。

20 また、本発明には、以下の発明も包含される。

[1] 式(I)：



(式中、R<sup>1</sup>は水素、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換

されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式： $-Y^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$ （式中、 $Y^1$ 及び $Y^3$ はそれぞれ独立して単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり； $Y^2$ は単結合、 $-O-$ 、 $-O-C(=O)-$ 、 $-O-C(=O)-O-$ 、 $-O-C(=O)-NR^b-$ 、 $-O-SO_2-$ 、 $-NR^b-C(=O)-$ 、 $-NR^b-SO_2-$ 、 $-NR^b-C(=O)-NR^b-$ 、 $-NR^b-C(=NH)-$ 、 $-NR^b-C(=O)-O-$ 、 $-NR^b-C(=O)-NR^b-$ 、 $-NR^b-C(=S)-$ 、 $-NR^b-C(=S)-NR^b-$ 、 $-NR^b-SO_2-NR^b-$ 、 $-NR^b-C(=NH)-NR^b-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-O-$ 、 $-SO_2-NR^b-$ 、 $-SO_2-NR^b-C(=O)-NR^b-$ 、 $-C(=O)-O-$ 、 $-C(=O)-NR^b-$ 、 $-C(=O)-NR^b-C(=S)-$ 、 $-C(=S)-NR^b-$ 、 $-C(=S)-NR^b-C(=O)-$ 又は $-C(=NH)-NR^b-$ であり； $R^a$ は置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基又はアシルであり； $R^b$ はそれぞれ独立して水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基又はアシルである）で示される基であり；

$R^2$ は水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式： $-Y^4 - R^\circ$ （式中、 $Y^4$ は単結合、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-C(=O)-NH-$ 又は $-NH-C(=O)-$ であり； $R^\circ$ は置換されていてもよい炭素環式基

又は置換されていてもよい複素環式基である)で示される基であり;

R<sup>3</sup>は水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式: -Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup> (式中、Y<sup>5</sup>は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、-O-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-NH-、-C(=O)-、-CH<sub>2</sub>-、-C(=O)-NH-、-NH-C(=O)-又は-C(=O)-NH-置換されていてもよいアルキレンーであり; R<sup>d</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である)で示される基であり;

R<sup>4</sup>は水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ又はニトロであり;

R<sup>5</sup>は水素、ヘテロ原子及び/又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよいアルキル又は式: -Y<sup>6</sup>-R<sup>e</sup> (式中、Y<sup>6</sup>は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、-O-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-NH-、-C(=O)-、-C(=O)-NH-、-NH-C(=O)-又は-C(=O)-NH-置換されていてもよいアルキレンーであり; R<sup>e</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である)で示される基であり;

又は、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>の組合せ、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>の組合せ、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>の組合せのいずれか一つの組合せが一緒になってヘテロ原子及び/又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよいアルキレンであり;

XはS又はOである；

但し、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>のすべてが同時に水素である場合、及びR<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になってアルコキシでジ置換されたブタジエニレンであり、かつR<sup>5</sup>が水素又はメチルである場合を除く。)で示される化合物、そのプロドラッグ、その  
5 製薬上許容される塩又はその溶媒和物を有効成分として含有するカンナビノイド  
2型受容体親和性医薬組成物、

[2] R<sup>5</sup>がヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換され  
ていてもよい炭素数2以上のアルキル又は式：-Y<sup>6</sup>-R<sup>e</sup>（式中、Y<sup>6</sup>及びR<sup>e</sup>  
は上記[1]と同意義である）で示される基である上記[1]記載のカンナビノイド2  
10 型受容体親和性医薬組成物、

[3] R<sup>5</sup>がヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換され  
ていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式：-Y<sup>6</sup>-R<sup>e</sup>（式中、Y<sup>6</sup>は置換さ  
れていてもよいアルケンであり；R<sup>e</sup>は置換されていてもよいアリール、置換さ  
れていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換  
15 されていてもよいヘテロサイクルである）で示される基である上記[2]記載のカン  
ナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

[4] R<sup>1</sup>が式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Y<sup>3</sup>、R<sup>a</sup>及びR<sup>b</sup>  
bは上記[1]と同意義である）で示される基である上記[1]～[3]のいずれかに記載  
のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

20 [5] R<sup>1</sup>が式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>、Y<sup>3</sup>及びR<sup>a</sup>は上記[1]  
と同意義であり；Y<sup>2</sup>は-O-、-NR<sup>b</sup>-C(=O)-又は-C(=O)-NR<sup>b</sup>-  
bであり；R<sup>b</sup>は水素又は置換されていてもよいアルキルである）で示される基  
である上記[4]記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

[6] R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になつてない上記[1]～[5]のいずれかに記載のカ  
25 ナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

[7] R<sup>3</sup>が水素、置換されていてもよいアルキル、ハロゲン又は式：-Y<sup>5</sup>  
-R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合、置換されていてもよいアルケン、アルケニレン、

アルキニレンであり；R<sup>d</sup>は置換されていてもよいアリール又は置換されていてもよいヘテロアリールである)で示される基であり；R<sup>4</sup>が水素又は置換されていてもよいアルキルである(但し、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が同時に水素である場合を除く。)上記[6]記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

5 [8] R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になってヘテロ原子及び/又は不飽和結合が介在しててもよい置換されていてもよいアルキレン(但し、置換されていてもよいブタジエニレンでない)である上記[1]～[5]のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

[9] R<sup>1</sup>が水素、アミノ、ホルミル、カルボキシ、イソチオシアナト、アミノ、ヒドロキシ又は式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>(式中、Y<sup>1</sup>及びY<sup>3</sup>はそれぞれ独立して単結合又は置換されていてもよいアルキレン(置換基としては、ハロゲン、アルケニレン、ヒドロキシ又はアジド)であり；Y<sup>2</sup>は単結合、-O-、-O-C(=O)-、-O-C(=O)-O-、-O-C(=O)-NH-、-NH-、-NR<sup>b</sup>-C(=O)-、-NH-C(=O)-O-、-NH-C(=O)-NH-、-NH-C(=S)-NH-、-S-、-SO<sub>2</sub>-O-、-SO<sub>2</sub>-NH-、-SO<sub>2</sub>-NH-C(=O)-NH-、-C(=O)-O-、-C(=O)-NR<sup>b</sup>-又は-C(=S)-NH-であり；R<sup>a</sup>が置換されていてもよいアルキル(置換基としては、ヒドロキシ)、アルケニル、置換されていてもよいアリール(置換基としては、カルボキシ、置換されていてもよいアミノ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケンジオキシ、ハロゲン、アルキル又はヒドロキシ)、置換されていてもよいシクロアルキル(置換基としては、アリール)、置換されていてもよいシクロアルケニル(置換基としては、アルケニレン)又は置換されていてもよいヘテロアリール(置換基としては、オキソ)であり；R<sup>b</sup>が水素、アルキル又はアシルである)で示される基であり；

10 R<sup>2</sup>が水素、アルキル、アルケニル又は式：-Y<sup>4</sup>-R<sup>c</sup>(式中、Y<sup>4</sup>が-O-であり；R<sup>c</sup>がヘテロアリールである)で示される基であり；

15 R<sup>3</sup>が水素、アルキル、ハロゲン又は式：-Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup>(式中、Y<sup>5</sup>は単結合、アル

キニレン又は $-C(=O)-NH-$ アルキレンーであり；R<sup>d</sup>はハロゲンで置換されていてもよいアリール（置換基としては、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ、ハロアルキル）又は置換されていてもよいヘテロアリール（置換基としては、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ又はハロアルキル）である）で示される基であり；

R<sup>4</sup>が水素又はアルキルであり；

R<sup>5</sup>が水素、ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル（置換基としては、ハロゲン、ヒドロキシ又はアジド）又は式： $-Y^6-R^e$ （式中、Y<sup>6</sup>はアルキレンであり；R<sup>e</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロサイクルである）で示される基であり；

又は、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>が一緒になって置換されていてもよいアルキレン（置換基としては、オキソ又はヒドロキシ）であるか、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になってヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよいアルキレン（置換基としては、アシル、アラルキル又はアルケニレン）であるか、又はR<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>が一緒になって不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよいアルキレン（置換基としては、アルケニレン）である上記[1]記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

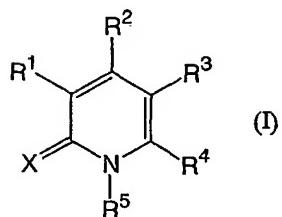
[10] 抗炎症剤である上記[1]～[9]のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

[11] 免疫抑制剤である上記[1]～[9]のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

[12] 腎炎治療剤である上記[1]～[9]のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

[13] 鎮痛剤である上記[1]～[9]のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物、

[14] 式(I) :



- (式中、R<sup>1</sup>は式 : -Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup> (式中、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Y<sup>3</sup>及びR<sup>b</sup>は上記[1]と同意義であり ; R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基又はアシルである) で示される基であり ;
- R<sup>2</sup>は水素又は置換されていてもよいアルキルであり ;
- R<sup>3</sup>は置換されていてもよいアルキル、ハロゲン又は式 : -Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup> (式中、Y<sup>5</sup>は単結合又はアルキニレンであり ; R<sup>d</sup>は上記[1]と同意義である) で示される基であり ;
- R<sup>4</sup>は水素又は置換されていてもよいアルキルであり ;
- R<sup>5</sup>はヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式 : -Y<sup>6</sup>-R<sup>e</sup> (式中、Y<sup>6</sup>及びR<sup>e</sup>は上記[1]と同意義である) で示される基であり ;
- 又は、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は一緒になってヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在してもよいアルキレンであり ;
- Xは上記[1]と同意義である ;
- 但し、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって置換されていてもよいブタジエニレンである場合は、R<sup>1</sup>が式 : -Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup> (式中、Y<sup>1</sup>が単結合であり ; Y<sup>3</sup>が置換されていてもよいアルキレンであり ; Y<sup>2</sup>は-NR<sup>b</sup>-C(=O)-、-C(=O)-NR<sup>b</sup>-であり ; R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基であり ; R<sup>b</sup>は水素又は置換されていてもよいアルキルである。) で示される基である ;
- なお、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になってテトラメチレンであり、かつR<sup>1</sup>が式 : -Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup> (式中、Y<sup>1</sup>及びY<sup>3</sup>が単結合であり ; Y<sup>2</sup>が-O-であり ; R<sup>a</sup>

フェニルである)で示される基である場合及びR<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になってブタジエニレンであり、かつR<sup>1</sup>が式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>(式中、Y<sup>1</sup>が単結合であり、Y<sup>3</sup>がエチレンであり、Y<sup>2</sup>が-C(=O)-NR<sup>b</sup>-であり、かつR<sup>a</sup>がスルファモイルで置換されたフェニルである)で示される基である場合を除く。)

- 5 で示される化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

[15] R<sup>1</sup>が式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>(式中、Y<sup>1</sup>、Y<sup>3</sup>及びR<sup>a</sup>は上記[14]と同意義であり；Y<sup>2</sup>は-O-、-NR<sup>b</sup>-C(=O)-又は-C(=O)-NR<sup>b</sup>-であり；R<sup>b</sup>は水素又は置換されていてもよいアルキルである)で示される基である上記[14]記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

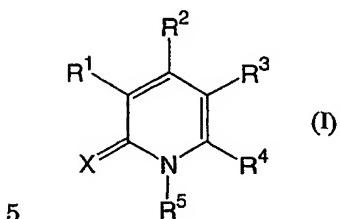
[16] R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になつてない上記[14]又は[15]記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

[17] R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になつてヘテロ原子及び/又は不飽和結合が介在していてもよいアルキレンである上記[14]又は[15]記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

[18] R<sup>1</sup>が式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>(式中、Y<sup>1</sup>は単結合であり；Y<sup>3</sup>は置換されていてもよいアルキレンであり；Y<sup>2</sup>は-O-、-NH-C(=O)-又は-C(=O)-NH-であり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である)で示される基であり；R<sup>2</sup>が水素であり；R<sup>3</sup>がアルキル、ハロゲン又は式：-Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup>(式中、Y<sup>5</sup>は単結合であり；R<sup>d</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である)で示される基であり；R<sup>4</sup>が水素又はアルキルであり；R<sup>5</sup>が置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式：-Y<sup>6</sup>-R<sup>e</sup>(式中、Y<sup>6</sup>は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>e</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル又は置換されていてもよいヘテロアリールである)で示される基であり；

又は R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> は一緒になってヘテロ原子が介在していてもよいアルキレンである上記[1 4]記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

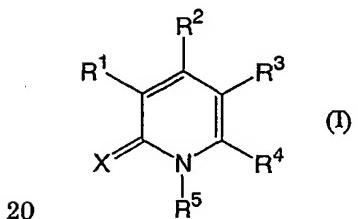
[19] 式(I) :



(式中、R<sup>1</sup>は式 : -Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup> (式中、Y<sup>1</sup>は単結合であり; Y<sup>3</sup>は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり; Y<sup>2</sup>は-C(=O)-NR<sup>b</sup>-であり; R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基であり; R<sup>b</sup>は水素である)で示される基であり; R<sup>2</sup>は水素であり; R<sup>3</sup>及び R<sup>4</sup>は一緒になってアルキレンであり; R<sup>5</sup>は炭素数3以上のアルキル又は式 : -Y<sup>6</sup>-R<sup>e</sup> (式中、Y<sup>6</sup>は置換されていてもよいアルキレンであり; R<sup>e</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル又は置換されていてもよいヘテロアリールである)で示される基であり; XはS又はOである。)で示される化合物のライブラリー、

[20] 上記[19]記載の化合物 (但し、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になってテトラメチレンであり、かつR<sup>1</sup>が式 : -Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup> (式中、Y<sup>1</sup>及びY<sup>3</sup>が単結合であり; Y<sup>2</sup>が-O-であり; R<sup>a</sup>フェニルである)で示される基である場合を除く。)、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

[21] 式(I) :



(式中、R<sup>1</sup>は式 : -Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup> (式中、Y<sup>1</sup>は単結合であり; Y<sup>2</sup>は-

C (=O) - N R<sup>b</sup> - であり；Y<sup>3</sup>は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基であり；R<sup>b</sup>は水素である）で示される基であり；R<sup>2</sup>は水素であり；R<sup>3</sup>は式：- Y<sup>5</sup> - R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合、R<sup>d</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基であり；R<sup>4</sup>は水素又はアルキルであり；R<sup>5</sup>は炭素数3以上のアルキル又は式：- Y<sup>6</sup> - R<sup>e</sup>（式中、Y<sup>6</sup>は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>e</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル又は置換されていてもよいヘテロアリールである）で示される基であり；XはS又はOである。）で示される化合物のライ  
5  
10 ブラリー、

[22] 上記[21]記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物、

[23] 上記[14]～[18]、[20]又は[22]のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有する医薬組成物、

15 [24] カンナビノイド2型受容体親和性である上記[23]記載の医薬組成物、

[25] 抗炎症剤である上記[23]記載の医薬組成物、

[26] 免疫抑制剤である上記[23]記載の医薬組成物、

[27] 腎炎治療剤である上記[23]記載の医薬組成物、

[28] 鎮痛剤である上記[23]記載の医薬組成物。

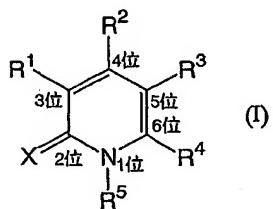
20 （なお、「一緒になってヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよいアルキレンである」とは、一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成する場合を意味する。）

25 本発明には、本発明化合物を投与することを特徴とする炎症又は腎炎の治疗方法、本発明化合物を投与することを特徴とする免疫の抑制方法、本発明化合物を投与することを特徴とする鎮痛方法、抗炎症剤、免疫抑制剤、腎炎治療剤又は鎮

痛剤を製造するための本発明化合物の使用も包含される。

また、本発明には、本発明化合物を有効成分として含有するカンナビノイド2型受容体が関与する疾患の治療剤、本発明化合物を投与することを特徴とするカンナビノイド2型受容体が関与する疾患の治疗方法、カンナビノイド2型受容体が関与する疾患の治療剤を製造するための本発明化合物の使用も包含される。  
5

本発明化合物は以下に示す式(I)で示されるピリドン誘導体である。ピリドン誘導体の位置番号を以下に示す。



- 10 (式中、R<sup>1</sup>は水素、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式：—Y<sup>1</sup>—Y<sup>2</sup>—Y<sup>3</sup>—R<sup>a</sup> (式中、Y<sup>1</sup>及びY<sup>3</sup>はそれぞれ独立して単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり；Y<sup>2</sup>は単結合、—O—、—O—C  
15 (=O)—、—O—C(=O)—O—、—O—C(=O)—NR<sup>b</sup>—、—O—SO<sub>2</sub>—、—NR<sup>b</sup>—、—NR<sup>b</sup>—C(=O)—、—NR<sup>b</sup>—S O<sub>2</sub>—、—NR<sup>b</sup>—C(=NH)—、—NR<sup>b</sup>—C(=O)—O—、—NR<sup>b</sup>—C(=O)—NR<sup>b</sup>—、—NR<sup>b</sup>—C(=O)—NR<sup>b</sup>—S O<sub>2</sub>—、—NR<sup>b</sup>—C(=S)—、—NR<sup>b</sup>—C(=S)  
20 —NR<sup>b</sup>—、—NR<sup>b</sup>—SO<sub>2</sub>—NR<sup>b</sup>—、—NR<sup>b</sup>—C(=NH)—NR<sup>b</sup>—、—S—、—SO<sub>2</sub>—O—、—SO<sub>2</sub>—NR<sup>b</sup>—、—SO<sub>2</sub>—NR<sup>b</sup>—C(=O)—NR<sup>b</sup>—、—C(=O)—O—、—C(=O)—NR<sup>b</sup>—、—C(=O)—NR<sup>b</sup>  
—C(=O)—、—C(=O)—NR<sup>b</sup>—C(=S)—、—C(=S)—NR<sup>b</sup>—、—C(=S)—NR<sup>b</sup>—C(=O)—、—C(=O)—NR<sup>b</sup>—C(=O)—、—C(=O)—NR<sup>b</sup>—、—C(=O))

—、 $-C(=O)-NR^b-C(=O)R^b$ —又は $-C(=O)-NR^b-NR^b$ —であり； $R^a$ は置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基又はアシルであり； $R^b$ はそれぞれ独立して水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基、アシル、ヒドロキシ又はアルコキシである）で示される基であり； $R^2$ は水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式： $-Y^4-R^c$ （式中、 $Y^4$ は単結合、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-C(=O)-NH-$ 又は $-NH-C(=O)-$ であり； $R^c$ は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基であり； $R^3$ 及び $R^4$ はそれぞれ独立して、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式： $-Y^5-R^d$ （式中、 $Y^5$ は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-C(=O)-NH-E-$ 又は $-NH-C(=O)-$ であり； $E$ は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり； $R^d$ は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基であり；

R<sup>5</sup>は水素、ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されてもよいアルキル又は式：－Y<sup>6</sup>—R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>6</sup>は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、－O－、－S－、－SO－、－SO<sub>2</sub>－、－NH－、－C(=O)－、－C(=O)－NH－E－又は－NH－C(=O)－であり；Eは単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基であり；

又は、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>の組合わせ、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>の組合わせ、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>の組合わせのいずれか一つの組合わせが一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成していく もよく；

XはS又はOである；

但し、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共にアルコキシでジ置換されたベンゼン環を形成し、かつR<sup>5</sup>が水素又はメチルである場合を除く。）

15

本発明化合物はピリドン骨格を有することを特徴とし、特に、少なくともR<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>のいずれか一つが置換されていることが挙げられる。

本発明化合物の好ましい態様としては、以下のものが挙げられる。

R<sup>1</sup>について

20 1) R<sup>1</sup>が式：－Y<sup>1</sup>—Y<sup>2</sup>—Y<sup>3</sup>—R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Y<sup>3</sup>、R<sup>a</sup>及びR<sup>b</sup>は上記（1）と同意義である）で示される基である場合、  
2) R<sup>1</sup>が水素、シアノ、ホルミル、カルボキシ、イソチオシアナト、アミノ、ヒドロキシ、カルバモイル又は式：－Y<sup>1</sup>—Y<sup>2</sup>—Y<sup>3</sup>—R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>及びY<sup>3</sup>はそれぞれ独立して単結合又は置換されていてもよいアルキレン（置換基としては、  
25 ハロゲン、アルケニレン、ヒドロキシ、アジド、アミノ、アシリルアミノ、アルキルスルホニルアミノ、アルケニルオキシカルボニルアミノ、アルコキシカルボニルアミノ、アルケニルアミノ、アリールカルボニルアミノ、ヘテロアリールカル

ボニルアミノ、シアノ、アルコキシ、アルキルスルホニルオキシ、トリアルキルシリルオキシ、オキソ、メチレン、ハロゲン化アルコキカルボニルオキシ、ホルミルオキシ及び／又はアシルチオ)であり；Y<sup>2</sup>は単結合、-O-、-O-C(=O)-、-O-C(=O)-O-、-O-C(=O)-NH-、-NH-、-N  
 5 R<sup>b</sup>-C(=O)-、-NH-C(=O)-O-、-NH-C(=O)-NH-、-NH-C(=S)-NH-、-S-、-SO<sub>2</sub>-O-、-SO<sub>2</sub>-NH-、-SO<sub>2</sub>-NH-C(=O)-NH-、-C(=O)-O-、-C(=O)-NR<sup>b</sup>-、  
 -C(=S)-NH-、-C(=O)-NH-C(=O)-、-C(=O)-NH-C(=S)-、-C(=O)-NR<sup>b</sup>-C(=NR<sup>b</sup>)—又  
 10 は-C(=O)-NH-NR<sup>b</sup>-であり；R<sup>a</sup>が置換されていてもよいアルキル(置換基としては、ヒドロキシ及び／又はアラルキル)、アルケニル、置換されていてもよいアリール(置換基としては、カルボキシ、置換されていてもよいアミノ、アルコキシ、アルキルチオ、アルキレンジオキシ、ハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン化アルキル及び／又はハロゲン化アルコキシ)、置換されていてもよいシクロアルキル(置換基としては、アリール及び／又はヒドロキシ)、置換されていてもよいシクロアルケニル(置換基としては、アルケニレン、ヒドロキシ、アルキルスルホニルオキシ、アジド、アミノ及び／又はアシルアミノ)、置換されていてもよいヘテロアリール(置換基としては、オキソ、ヘテロアリール、ハロゲン、アリール及び／又はアルキル)又は置換されていてもよいヘテロサイクル(置換基としては、ハロゲンで置換されていてもよいアリール、アラルキル、アシル、アリールカルボニル、シクロアルキルカルボニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アルキル及び／又はハロゲン化アルキルカルボニル)であり；R<sup>b</sup>が水素、アルキル、アシル、ヒドロキシ及び／又はアルコキシである)で示される基である場合、  
 15 25 3) R<sup>1</sup>が式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>(式中、Y<sup>1</sup>、Y<sup>3</sup>及びR<sup>a</sup>は上記(1)と同意義であり；Y<sup>2</sup>は-O-、-NR<sup>b</sup>-C(=O)—又は-C(=O)-NR<sup>b</sup>-であり；R<sup>b</sup>は水素又は置換されていてもよいアルキルである)で示される基で

ある場合、

- 4)  $R^1$  が式 :  $-Y^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$  (式中、  $Y^1$ 、  $Y^2$ 、  $Y^3$  及び  $R^b$  は上記(1)と同意義であり ;  $R^a$  は置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基又はアシルである) で示される基である場合、
- 5)  $R^1$  が式 :  $-Y^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$  (式中、  $Y^1$  は単結合であり ;  $Y^3$  は置換されていてもよいアルキレンであり ;  $Y^2$  は  $-O-$ 、  $-NH-C(=O)-$  又は  $-C(=O)-NH-$  であり ;  $R^a$  は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である) で示される基である場合、
- 6)  $R^1$  が式 :  $-Y^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$  (式中、  $Y^1$  は単結合であり ;  $Y^3$  は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり ;  $Y^2$  は  $-C(=O)-NR^b-$  であり ;  $R^a$  は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基であり ;  $R^b$  は水素である) で示される基である場合、
- 7)  $R^1$  が式 :  $-Y^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$  (式中、  $Y^1$  は単結合であり ;  $Y^3$  は置換されていてもよいアルキレンであり ;  $Y^2$  は  $-C(=O)-NR^b-$  又は  $-NR^b-C(=O)-$  であり ;  $R^a$  は置換されていてもよいアリール又は置換されていてもよいヘテロアリールであり ;  $R^b$  は水素である) で示される基である場合、
- 8)  $R^1$  が式 :  $-Y^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$  (式中、  $Y^1$  は単結合であり ;  $Y^3$  は置換されていてもよい分枝状のアルキレンであり ;  $Y^2$  は  $-O-$ 、  $-NH-C(=O)-$  又は  $-C(=O)-NH-$  であり ;  $R^a$  は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である) で示される基である場合、

#### $R^2$ について

- 1)  $R^2$  が水素、アルキル、アルケニル又は式 :  $-Y^4-R^c$  (式中、  $Y^4$  が  $-O-$  であり ;  $R^c$  がヘテロアリールである) で示される基である場合、
- 2)  $R^2$  が水素又は置換されていてもよいアルキルである場合、
- 3)  $R^2$  が水素である場合、

**R<sup>3</sup>について**

- 1) R<sup>3</sup>が式：-Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合、R<sup>d</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基である場合、
- 2) R<sup>3</sup>が水素、置換されていてもよいアルキル、ハロゲン又は式：-Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup>  
5 (式中、Y<sup>5</sup>は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレンであり；R<sup>d</sup>は置換されていてもよいアリール又は置換されていてもよいヘテロアリールである)で示される基である場合、
- 3) R<sup>3</sup>がアルキル、ハロゲン又は式：-Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合であり；R<sup>d</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基で  
10 ある）で示される基である場合、
- 4) R<sup>3</sup>が水素、アルキル、ハロゲン又は式：-Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合、アルキニレン又は-C(=O)-NH-アルキレン-であり；R<sup>d</sup>は置換されていてもよいアリール（置換基としては、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ及び／又はハロゲン化アルキル）又は置換されていてもよいヘテロアリール（置換基としては、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ及び／又はハロゲン化アルキル）である）で示される基である場合、
- 5) R<sup>3</sup>が置換されていてもよいアルキル、ハロゲン又は式：-Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合又はアルキニレンであり；R<sup>d</sup>は上記（1）と同意義である）で示される基である場合、
- 20 6) R<sup>3</sup>が水素、アルキル又は式：-Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合又はアルキニレンであり；R<sup>d</sup>は置換されていてもよいアリール又は置換されていてもよいヘテロアリールである）で示される基である場合、
- 7) R<sup>3</sup>がアルキルである場合、

**R<sup>4</sup>について**

- 1) R<sup>4</sup>が水素又は置換されていてもよいアルキルである場合、
- 2) R<sup>4</sup>が水素、アルキル又は式：-Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合であり；R<sup>d</sup>

はアリールである)で示される基である場合、

- 3) R<sup>4</sup>が水素である場合、
- 4) R<sup>4</sup>がアルキルである場合、

5 R<sup>5</sup>について

- 1) R<sup>5</sup>がヘテロ原子及び/又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい炭素数2以上のアルキル又は式：-Y<sup>6</sup>-R<sup>o</sup>(式中、Y<sup>6</sup>及びR<sup>o</sup>は上記(1)と同意義である)で示される基である場合、
- 2) R<sup>5</sup>が炭素数3以上のアルキル又は式：-Y<sup>6</sup>-R<sup>o</sup>(式中、Y<sup>6</sup>は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>o</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル又は置換されていてもよいヘテロアリールである)で示される基である場合、
- 3) R<sup>5</sup>が置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式：-Y<sup>6</sup>-R<sup>o</sup>(式中、Y<sup>6</sup>は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>o</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル又は置換されていてもよいヘテロアリールである)で示される基であり；
- 4) R<sup>5</sup>がヘテロ原子及び/又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式：-Y<sup>6</sup>-R<sup>o</sup>(式中、Y<sup>6</sup>は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>o</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロサイクルである)で示される基である場合、
- 5) R<sup>5</sup>が水素、ヘテロ原子及び/又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル(置換基としては、ハロゲン、ヒドロキシ、アジド、アミノ、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキルスルホニルオキシ、アシルチオ、アシルアミノ、アリールカルボニルアミノ、シクロアルキルカルボニルアミノ、ハロゲン化アルキルカルボニルアミノ、アルキルスルホニルアミノ、アリールスルホニルアミノ、ホルミル、オキソ及び/又はシアノ)又は式：-Y<sup>6</sup>

$-R^e$  (式中、 $Y^6$ はアルキレンであり； $R^e$ は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロサイクルである)で示される基である場合、

- 6)  $R^5$ がヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式： $-Y^6-R^e$ (式中、 $Y^6$ 及び $R^e$ は上記(1)と同意義である)で示される基である場合、
- 7)  $R^5$ が炭素数3以上のアルキル又は式： $-Y^6-R^e$ (式中、 $Y^6$ はアルキレンであり； $R^e$ は置換されていてもよいアリールである)で示される基である場合、
- 8)  $R^5$ が炭素数3以上のアルキルである場合、
- 9)  $R^5$ が式： $-Y^6-R^e$ (式中、 $Y^6$ はアルキレンであり； $R^e$ は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル又は置換されていてもよいヘテロアリールである)で示される基である場合、

#### $R^3$ 及び $R^4$ について

- 15 1)  $R^3$ 及び $R^4$ が一緒になっている場合、
- 2)  $R^3$ 及び $R^4$ が一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環(但し、置換されていてもよいベンゼン環でない)を形成する場合、
- 3)  $R^3$ 及び $R^4$ が一緒になって、隣接する原子と共に炭素環(但し、 $R^3$ が置換している炭素原子と $R^4$ が置換している炭素原子間の結合のみが二重結合であり、他の炭素原子間の結合は単結合である)を形成する場合、
- 4)  $R^3$ 及び $R^4$ が一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環(置換基としては、アシル、アラルキル、アルケニレン及び／又はアルキレン)を形成する場合、
- 25 5)  $R^3$ 及び $R^4$ が一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい環を形成する場合、
- 6)  $R^3$ 及び $R^4$ が一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子が介在していて

もよい環（但し、R<sup>3</sup>が置換している炭素原子とR<sup>4</sup>が置換している炭素原子間の結合のみが二重結合であり、他の原子間の結合は単結合である）を形成する場合、

7) R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共に非置換炭素環（但し、R<sup>3</sup>が置換している炭素原子とR<sup>4</sup>が置換している炭素原子間の結合のみが二重結合

5 であり、他の炭素原子間の結合は単結合である）を形成する場合、

R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>について

1) R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>が一緒になって、隣接する原子と共に置換されていてもよい炭素環（置換基としては、オキソ及び／又はヒドロキシ）を形成する場合、

10

R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>について

1) R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>が一緒になって、隣接する原子と共に不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環（置換基としては、アルケニレン）を形成する場合、

15

Xについて

1) Xが酸素原子である場合、

2) Xが硫黄原子である場合。

20 また、本発明化合物において、特に上記（25）～（28）の態様が好ましい。

本明細書で使用する用語を以下に説明する。本明細書中では特に断りのない限り、各用語は単独で又は他の用語と一緒にになって、同じ意味を有する。

25 「ハロゲン」とは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素を意味する。

「ヘテロ原子」とは、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を意味する。

「ヘテロ原子が介在していてもよい環（又はアルキル）」とは、その環（又は

アルキル) の一部に  $-NR-$ 、 $-N=$ 、 $=N-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$  (R は水素又は有機残基 (例えばアルキル等)) が 1 ~ 数個介在していてもよい環を意味する。

「不飽和結合」とは、二重結合、三重結合を意味する。

「不飽和結合が介在していてもよい環 (又はアルキル)」とは、その環 (又は  
5 アルキル) の一部に  $-CR=CR-$ 、 $-C=N-$ 、 $-C\equiv C-$  (R はそれぞれ独立して有機残基 (例えばアルキル等)) が 1 ~ 数個介在していてもよい環を意味する。

「アルキル」とは、炭素数 1 ~ 12 の直鎖状又は分枝状のアルキルを意味し、  
10 例えば、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、イソペンチル、neo-ペンチル、n-ヘキシル、n-ヘプチル、n-オクチル、n-ノニル、n-デシルなどが挙げられる。

R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> のアルキルとしては、特に、炭素数 1 ~ 4 の直鎖状又は分枝状のアルキルが好ましく、具体的には、メチル、エチル、n-プロピル、  
15 イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチルが好ましい。

R<sup>5</sup> の「ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよいアルキル」とは、ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい上記「アルキル」を意味し、特に炭素数 2 以上のアルキルが好ましく、さらには、炭素数 3 以上のアルキルが好ましい。炭素数 3 以上のアルキルとしては、例えば、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、n-ヘキシル、n-ヘプチル、n-オクチル、n-ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル等が挙げられる。

25 「ヘテロ原子が介在した上記アルキル」としては、1 ~ 3 個のヘテロ原子が介在した炭素数 3 ~ 12 の直鎖状又は分枝状のアルキルが好ましい。特に 1 個のヘテロ原子が介在した炭素数 3 ~ 8 のアルキルが好ましく、このようなアルキルと

しては、「アルコキシアルキル」、「アルキルチオアルキル」、「アルキルアミノアルキル」等が挙げられる。

「アルコキシ」とは、酸素原子に上記「アルキル」が置換した基を意味し、例えば、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシ、n-ペンチルオキシ、n-ヘキシルオキシ、n-ヘプチルオキシ、n-オクチルオキシなどが挙げられる。特に、炭素数1～4の直鎖又は分枝状のアルコキシが好ましく、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシが好ましい。

10 「アルキルチオ」とは、硫黄原子に上記「アルキル」が置換した基を意味し、例えば、メチルチオ、エチルチオ、n-プロビルチオ、イソプロビルチオ、n-ブチルチオ、イソブチルチオ、sec-ブチルチオ、tert-ブチルチオ、n-ベンチルチオ、n-ヘキシルチオ等が挙げられる。特に、炭素数1～4の直鎖又は分枝状のアルキルチオが好ましく、メチルチオ、エチルチオ、n-プロビルチオ、イソプロビルチオ、n-ブチルチオ、イソブチルチオ、sec-ブチルチオ、tert-ブチルチオが好ましい。

15 「アルキルアミノ」とは、アミノ基に上記「アルキル」が置換した基を意味し、例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロビルアミノ、イソプロビルアミノ、n-ブチルアミノ、イソブチルアミノ、sec-ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、n-ベンチルアミノ、n-ヘキシルアミノ等が挙げられる。特に、炭素数1～4の直鎖又は分枝状のアルキルアミノが好ましく、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロビルアミノ、イソプロビルアミノ、n-ブチルアミノ、イソブチルアミノ、sec-ブチルアミノ、tert-ブチルアミノが好ましい。

20 「アルコキシアルキル」とは、上記「アルキル」に上記「アルコキシ」が置換した基を意味し、例えば、メトキシメチル、エトキシメチル、n-プロポキシメチル、1-メトキシエチル、2-メトキシエチル、1-エトキシエチル、2-エトキシエチル、1-n-プロポキシエチル、2-n-プロポキシエチル、1-メトキシ-n-プロビル、2-メトキシ-n-プロビル、3-メトキシ-n-プロビル、1-エトキシ-n-プロビル、2-エトキシ-

n-プロピル、3-エトキシ-n-プロピル、1-n-プロポキシ-n-プロピル、2-n-プロポキシ-n-プロピル、3-n-プロポキシ-n-プロピル等が挙げられる。

「アルキルチオアルキル」とは、上記「アルキル」に上記「アルキルチオ」が置換した基を意味し、例えば、メチルチオメチル、エチルチオメチル、n-プロピルチオメチル、1-メチルチオエチル、2-メチルチオエチル、1-エチルチオエチル、2-エチルチオエチル、1-n-プロピルチオエチル、2-n-プロピルチオエチル、3-n-プロピルチオエチル、1-メチルチオ-n-プロピル、2-メチルチオ-n-プロピル、3-メチルチオ-n-プロピル、1-エチルチオ-n-プロピル、2-エチルチオ-n-プロピル、3-エチルチオ-n-プロピル、1-n-プロピルチオ-n-プロピル、2-n-プロピルチオ-n-プロピル、3-n-プロピルチオ-n-プロピル等が挙げられる。

「アルキルアミノアルキル」とは、上記「アルキル」に上記「アルキルアミノ」が置換した基を意味し、例えば、メチルアミノメチル、エチルアミノメチル、n-プロピルアミノメチル、1-メチルアミノエチル、2-メチルアミノエチル、1-エチルアミノエチル、2-エチルアミノエチル、1-n-プロピルアミノエチル、2-n-プロピルアミノエチル、3-n-プロピルアミノエチル、1-メチルアミノ-n-プロピル、2-メチルアミノ-n-プロピル、3-メチルアミノ-n-プロピル、1-エチルアミノ-n-プロピル、2-エチルアミノ-n-プロピル、3-エチルアミノ-n-プロピル、1-n-プロピルアミノ-n-プロピル、2-n-プロピルアミノ-n-プロピル、3-n-プロピルアミノ-n-プロピル等が挙げられる。

20

「不飽和結合が介在した上記アルキル」としては、1又は2個の不飽和結合が介在した炭素数3～12の直鎖状又は分枝状のアルキルが好ましい。特に1個の不飽和結合が介在した炭素数3～8のアルキルが好ましく、このようなアルキルとしては、「アルケニル」、「アルキニル」等が挙げられる。

25 「アルケニル」は、上記「アルキル」に1個またはそれ以上の二重結合を有する炭素数2～12個の直鎖状または分枝状のアルケニル基を意味し、例えば、ビニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1,3-

ブタジエニル、3-メチル-2-ブテニル等が挙げられる。

「アルキニル」とは、上記「アルキル」に1個またはそれ以上の三重結合を有する炭素数2～12個のアルキニルを意味し、例えば、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル等が挙げられる。

5

「ハロゲン化アルキル」とは、上記「アルキル」に1以上のハロゲンが置換した基を意味し、例えば、クロロメチル、ジクロロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロエチル（例えば、1-クロロエチル、2-クロロエチル等）、ジクロロエチル（例えば、1,1-ジクロロエチル、1,2-ジクロロエチル、2,2-ジクロロエチル等）等が挙げられる。

「ハロゲン化アルコキシ」とは、上記「アルコキシ」に1以上のハロゲンが置換した基を意味し、例えば、ジクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシ（2,2,2-トリフルオロエトキシ等）等が挙げられる。

15

「アルキレン」は、炭素数1～12個の直鎖状または分枝状のアルキレン基を意味し、例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン、ヘプタメチレン、1-メチルエチレン、1-エチルエチレン、1,1-ジメチルエチレン、1,2-ジメチルエチレン、1,1-ジエチルエチレン、1,2-ジエチルエチレン、1-エチル-2-メチルエチレン、1-メチルトリメチレン、2-メチルトリメチレン、1,1-ジメチルトリメチレン、1,2-ジメチルトリメチレン、2,2-ジメチルトリメチレン、1-エチルトリメチレン、2-エチルトリメチレン、1,1-ジエチルトリメチレン、1,2-ジエチルトリメチレン、2,2-ジエチルトリメチレン、2-エチル-2-メチルトリメチレン、1-メチルテトラメチレン、2-メチルテトラメチレン、1,1-ジメチルテトラメチレン、1,2-ジメチルテトラメチレン、2,2-ジメチルテトラメチレン、2,2-ジ-n-プロピルトリメチレン等が挙げられる。

Y<sup>1</sup>、Y<sup>3</sup>、Y<sup>5</sup>、Y<sup>6</sup>、-C(=O)-NH-アルキレン-の「アルキレン」と

しては、炭素数 1～10 の直鎖状のアルキレン、特に、炭素数 1～4 個の直鎖状のアルキレン基（例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン）、さらには炭素数 1 又は 2 の直鎖状のアルキレン（例えばメチレン、エチレン）が好ましい。

- 5 R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>の組合わせ、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>の組合わせ、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>の組合わせのいずれか一つの組合わせが一緒にになって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成する場合の「環」は、ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい上記「アルキレン」を意味する。特に、炭素数 2 以上のアルキレンが好ましく、さらには炭素  
10 数 3 以上のアルキレンが好ましい。特に炭素数 3～6 の直鎖状のアルキレンが好ましい。

なお、「ヘテロ原子が介在する」「不飽和結合が介在する」の意味は、上記と同様である。

- 15 「アルケニレン」は、上記「アルキレン」に 1 個またはそれ以上の二重結合を有する炭素数 2～12 個の直鎖状または分枝状のアルケニレン基を意味し、例えば、ビニレン、プロペニレンまたはブテニレンが挙げられる。好ましくは、炭素数 2～6 個の直鎖状のアルケニレン基であり、ビニレン、プロペニレン、ブテニレン、ペンテニレン、ヘキセニレン、ブタジエニレン等である。  
20 「アルキニレン」とは、上記「アルキレン」に 1 個またはそれ以上の二重結合を有する炭素数 2～12 個の直鎖状または分枝状のアルケニレン基を意味する。

「アシル」とは、水素以外の基が置換したカルボニル基を意味し、例えば、アルキルカルボニル（例えば、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、ヒバロイル、ヘキサノイル、オクタノイル、ラウロイル等）、アルケニルカルボニル（例えば、アクリロイル、メタアクリロイル）、シクロアルキルカルボニル（例えば、シクロプロパンカルボニル、シクロブタン

カルボニル、シクロヘキサンカルボニル、シクロヘキサンカルボニル等)、アリールカルボニル(ベンゾイル、ナフトイル等)、ヘテロアリールカルボニル(ピリジルカルボニル等)が挙げられる。これらの基はさらにアルキル、ハロゲン等の置換基で置換されていてもよい。例えば、アルキルが置換したアリールカルボニルとしてはトルオイル基、ハロゲンが置換したアルキルカルボニル基としてはトリフルオロアセチル基等が挙げられる。

「アルケニルオキシ」とは、酸素原子に上記「アルケニル」が置換した基を意味し、例えば、ビニルオキシ、1-プロペニルオキシ、2-プロペニルオキシ、1-ブテニルオキシ、2-ブテニルオキシ、3-ブテニルオキシ、1,3-ブタジエニルオキシ、3-メチル-2-ブテニルオキシ等が挙げられる。

「アルキニルオキシ」とは、酸素原子に上記「アルケニル」が置換した基を意味し、例えば、エチニルオキシ、1-プロピニルオキシ、2-プロピニルオキシ、1-ブチニルオキシ、2-ブチニルオキシ、3-ブチニルオキシ等が挙げられる。

「アルコキシカルボニル」とは、カルボニルに上記「アルコキシ」が置換した基を意味し、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、i-プロポキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、i-ブトキシカルボニル、sec-ブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル、n-ペンチルオキシカルボニル、n-ヘキシルオキシカルボニル、n-ヘプチルオキシカルボニル、n-オクチルオキシカルボニル等が挙げられる。特に、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル等が好ましい。

「アルキルスルフィニル」とは、スルフィニルに上記「アルキル」が置換した基を意味し、特に、メタンスルフィニル、エタンスルフィニル等が好ましい。

「アルキルスルホニル」とは、スルホニルに上記「アルキル」基が置換した基を意味し、特に、メタンスルホニル、エタンスルホニル等が好ましい。

「アシルアミノ」のアシル部分は、上記「アシル」と同意義であり、「アシルアミノ」としては、特に、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ベンゾイルアミノが好ましい。

「アルキルスルホニルアミノ」のアルキルスルホニル部分は、上記「アルキルスルホニル」と同意義であり、「アルキルスルホニルアミノ」としては、特に、メタンスルホニルアミノ、エタンスルホニルアミノが好ましい。

「アルケニルオキシカルボニルアミノ」のアルケニルオキシ部分は、上記「アルケニルオキシ」と同意義であり、「アルケニルオキシカルボニルアミノ」としては、特に、ビニルオキシカルボニルアミノ、アリルオキシカルボニルアミノが好ましい。

「アルコキシカルボニルアミノ」のアルコキシカルボニル部分は、上記「アルコキシカルボニル」と同意義であり、「アルコキシカルボニルアミノ」としては、特に、メトキシカルボニルアミノ、エトキシカルボニルアミノ、*tert*-ブトキシカルボニルアミノが好ましい。

「アルケニルアミノ」のアルケニル部分は、上記「アルケニル」と同意義であり、「アルケニルアミノ」としては、特に、ビニルアミノ、アリルアミノが好ましい。

「アリールカルボニルアミノ」のアリール部分は、上記「アリール」と同意義であり、「アリールカルボニルアミノ」としては、特に、ベンゾイルアミノ、ナフトイルアミノが好ましい。

「ヘテロアリールカルボニルアミノ」のヘテロアリール部分は、上記「ヘテロアリール」と同意義であり、「ヘテロアリールカルボニルアミノ」としては、特に、ピリジンカルボニルアミノが好ましい。

「アルキルスルホニルオキシ」のアルキルスルホニル部分は、上記「アルキルスルホニル」と同意義であり、「アルキルスルホニルオキシ」としては、特に、メタンスルホニルオキシ、エタンスルホニルオキシが好ましい。

「トリアルキルシリルオキシ」としては、*tert*-ブチルジメチルシリルオキシが

好ましい。

「ハロゲン化アルコキシカルボニルオキシ」のハロゲン化アルコキシ部分は、上記「ハロゲン化アルコキシ」と同意義であり、「ハロゲン化アルコキシカルボニルオキシ」としては、特に、トリフルオロメトキシカルボニルオキシ、トリクロロメトキシカルボニルオキシが好ましい。

「アシルチオ」のアシル部分は、上記「アシル」と同意義であり、「アシルチオ」としては、特に、アセチルチオが好ましい。

「アリールカルボニル」のアリール部分は、上記「アリール」と同意義であり、「アリールカルボニル」としては、特に、ベンゾイル、ナフトイルが好ましい。

10 「シクロアルキルカルボニル」のシクロアルキル部分は、上記「シクロアルキル」と同意義であり、「シクロアルキルカルボニル」としては、特に、シクロブロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロヘキシリカルボニルが好ましい。

「アリールスルホニル」のアリール部分は、上記「アリール」と同意義であり、15 「アリールスルホニル」としては、特に、ベンゼンスルホニルが好ましい。

「ハロゲン化アルキルカルボニル」のハロゲン化アルキル部分は、上記「ハロゲン化アルキル」と同意義であり、「ハロゲン化アルキルカルボニル」としては、特に、トリフルオロメチルカルボニルが好ましい。

20 「アルキレンジオキシ」のアルキレン部分は、上記「アルキレン」と同意義であり、「アルキレンジオキシ」としては、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリメチレンジオキシ、テトラメチレンジオキシが好ましい。

「アラルキル」は、上記「アリール」が置換した上記「アルキル」を意味し、例えば、ベンジル、フェネチル、フェニルプロビル、ナフチルメチル、ナフチルエチル等が挙げられる。

25 「シクロアルキルカルボニルアミノ」のシクロアルキル部分は、上記「シクロアルキル」と同意義であり、「シクロアルキルカルボニルアミノ」としては、特に、シクロブロピルカルボニルアミノ、シクロブチルカルボニルアミノ、シクロ

ヘキシルカルボニルアミノが好ましい。

「ハロゲン化アルキルカルボニルアミノ」のハロゲン化アルキル部分は、上記「ハロゲン化アルキル」と同意義であり、「ハロゲン化アルキルカルボニルアミノ」としては、特に、トリフルオロメチルカルボニルアミノが好ましい。

- 5 「アリールスルホニルアミノ」のアリール部分は、上記「アリール」と同意義であり、「アリールスルホニルアミノ」としては、特に、ベンゼンスルホニルアミノが好ましい。

「置換されていてもよいアミノ」の置換基としては、アルキル（例えば、メチル、エチル、n-ブロピル、i-ブロピル等）、アシリル（例えば、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ベンゾイル等）、アラルキル（例えば、ベンジル、フェニルエチル、フェニルプロピルアミノ、ナフチルメチルアミノ等）等が挙げられる。アミノ基の窒素原子が、これらの置換基でモノ置換またはジ置換されていてもよい。

- 15 「置換されていてもよいアミノ」としては、非置換アミノ、アルキルアミノ（例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、n-ブロピルアミノ、i-ブロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、エチルメチルアミノ、プロピルメチルアミノ）、アシリルアミノ（例えば、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、プロピオニルアミノ、ベンゾイルアミノ）、アシリアルキルアミノ（例えば、N-アセチルメチルアミノ）、アラルキルアミノ（例えば、ベンジルアミノ、1-フェニルエチルアミノ、2-フェニルエチルアミノ、1-フェニルプロピルアミノ、2-フェニルプロピルアミノ、3-フェニルプロピルアミノ、1-ナフチルメチルアミノ、2-ナフチルメチルアミノ、ジベンジルアミノ等）、アルキルスルホニルアミノ（例えば、メタンスルホニルアミノ、エタンスルホニルアミノ等）、アルケニルオキシカルボニルアミノ（例えば、ビニルオキシカルボニルアミノ、アリルオキシカルボニルアミノ等）、アルコキシカルボニルアミノ（例えば、メトキシカルボニルアミノ、エトキシカルボニルアミノ、tert-ブトキシカルボニルアミノ等）、アルケニ

ルアミノ（例えば、ビニルアミノ、アリルアミノ等）、アリールカルボニルアミノ（例えば、ベンザイルアミノ等）、ヘテロアリールカルボニルアミノ（例えば、ピリジンカルボニルアミノ等）が挙げられる。

5 「置換されていてもよいカルバモイル」の置換基としては、アルキル（例えば、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル等）、アシル（例えば、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ベンザイル等）等が挙げられる。カルバモイル基の窒素原子が、これらの置換基でモノ置換またはジ置換されていてもよい。

10 「置換されていてもよいカルバモイル」としては、カルバモイル、N-メチルカルバモイル、N-エチルカルバモイル等が好ましい。

「炭素環式基」とは、炭素原子及び水素原子で構成される環状の置換基を意味し、環状部分は飽和環であっても不飽和環であってもよい。例えば、アリール、シクロアルキル、シクロアルケニル等が挙げられる。なお、炭素数3～14の環から誘導される基が好ましい。

15 「アリール」とは、炭素数6～14の芳香族炭素環式基を意味し、例えば、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントリル等が挙げられる。

20 「シクロアルキル」とは、炭素数3～7のシクロアルキルを意味し、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等が挙げられる。

「シクロアルケニル」とは、上記「シクロアルキル」に1個またはそれ以上の二重結合を有する炭素数3～12個のアルケニル基を意味し、例えば、シクロブロペニル（例えば、1-シクロブロペニル）、シクロブテニル（例えば、1-シクロブテニル）、シクロペンテニル（例えば、1-シクロペンテン-1-イル、2-シクロペンテン-1-イル、3-シクロペンテン-1-イル）、シクロヘキセニル（例えば、1-シクロヘキセン-1-イル、2-シクロヘキセン-1-イル、3-シクロヘキセン-1-イル）、シクロヘプテニル（例えば、1-シクロヘプテニル）、シクロオクテニル（例えば、1-

シクロオクテニル) 等が挙げられる。特に、1-シクロヘキセン-1-イル、2-シクロヘキセン-1-イル、3-シクロヘキセン-1-イルが好ましい。

「複素環式基」とは、上記「炭素環式基」の環状部分の炭素原子及び水素原子  
5 (例えば、 $-\text{CH}=\text{}$ 、 $-\text{CH}_2-$ ) が 1 ~ 5 個のヘテロ原子で置換された環から誘導される基を意味し、環を構成する部分は飽和環であっても不飽和環であってもよい。例えば、ヘテロアリール、ヘテロサイクル等が挙げられる。

「ヘテロアリール」とは、窒素原子、酸素原子、および／又は硫黄原子を 1 ~ 4 個含む炭素数 1 ~ 9 のヘテロアリールを意味し、例えば、フリル (例えば、2-フリル、3-フリル)、チエニル (例えば、2-チエニル、3-チエニル)、ピロリル (例えば、1-ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル)、イミダゾリル (例えば、1-イミダゾリル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル)、ピラゾリル (例えば、1-ピラゾリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル)、トリアゾリル (例えば、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル、1, 2, 4-トリアゾール-3-イル、1, 2, 4-トリアゾール-4-イル)、テトラゾリル (例えば、1-テトラゾリル、2-テトラゾリル、5-テトラゾリル)、オキサゾリル (例えば、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-オキサゾリル)、イソキサゾリル (例えば、3-イソキサゾリル、4-イソキサゾリル、5-イソキサゾリル)、チアゾリル (例えば、2-チアゾリル、4-チアゾリル、5-チアゾリル)、チアジアゾリル、イソチアゾリル (例えば、3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル、5-イソチアゾリル)、ピリジル (例えば、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル)、ピリダジニル (例えば、3-ピリダジニル、4-ピリダジニル)、ピリミジニル (例えば、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニル)、フラザニル (例えば、3-フラザニル)、ピラジニル (例えば、2-ピラジニル)、オキサジアゾリル (例えば、1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)、ベンゾフリル (例えば、2-ベンゾ[b]フリル、3-ベンゾ[b]フリル、4-ベンゾ[b]フリル、5-ベンゾ[b]フリル、6-ベンゾ[b]フリル、7-ベンゾ[b]フリル)、ベンゾチエニル (例えば、2-ベンゾ[b]チエニル、3-ベンゾ[b]チエニル、4-ベンゾ[b]チエニル、5-ベンゾ[b]チエニル、6-ベンゾ[b]チエニル、7-

ベンゾ[b]チエニル)、ベンズイミダゾリル(例えば、1-ベンゾイミダゾリル、2-ベンゾイミダゾリル、4-ベンゾイミダゾリル、5-ベンゾイミダゾリル)、ジベンゾフリル、ベンゾオキサゾリル(例えば、2-ベンゾオキサゾリル、4-ベンゾオキサゾリル、5-ベンゾオキサゾリル、6-ベンゾオキサゾリル、7-ベンゾオキサゾリル、8-ベンゾオキサゾリル)、キノキサリル(例えば、2-キノキサリニル、5-キノキサリニル、6-キノキサリニル)、シンノリニル(例えば、3-シンノリニル、4-シンノリニル、5-シンノリニル、6-シンノリニル、7-シンノリニル、8-シンノリニル)、キナゾリル(例えば、2-キナゾリニル、4-キナゾリニル、5-キナゾリニル、6-キナゾリニル、7-キナゾリニル、8-キナゾリニル)、キノリル(例えば、2-キノリル、3-キノリル、4-キノリル、5-キノリル、6-キノリル、7-キノリル、8-キノリル)、フタラジニル(例えば、1-フタラジニル、5-フタラジニル、6-フタラジニル)、イソキノリル(例えば、1-イソキノリル、3-イソキノリル、4-イソキノリル、5-イソキノリル、6-イソキノリル、7-イソキノリル、8-イソキノリル)、ブリル、ブテリジニル(例えば、2-ブテリジニル、4-ブテリジニル、6-ブテリジニル、7-ブテリジニル)、カルバゾリル、フェナントリジニル、アクリジニル(例えば、1-アクリジニル、2-アクリジニル、3-アクリジニル、4-アクリジニル、9-アクリジニル)、インドリル(例えば、1-インドリル、2-インドリル、3-インドリル、4-インドリル、5-インドリル、6-インドリル、7-インドリル)、イソインドリル、ファナジニル(例えば、1-フェナジニル、2-フェナジニル)またはフェノチアジニル(例えば、1-フェノチアジニル、2-フェノチアジニル、3-フェノチアジニル、4-フェノチアジニル)等が挙げられる。

「ヘテロサイクル」とは、窒素原子、酸素原子、および／又は硫黄原子を1～4個含む炭素数1～9の非芳香環を意味し、例えば、1-ピロリニル、2-ピロリニル、3-ピロリニル、ピロリジノ、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、1-イミダゾリニル、2-イミダゾリニル、4-イミダゾリニル、1-イミダゾリジニル、2-イミダゾリジニル、4-イミダゾリジニル、1-ピラゾリニル、3-ピラゾリニル、4-ピラゾリニル、1-ピラ

ゾリジニル、3-ピラゾリジニル、4-ピラゾリジニル、ピベリジノ、2-ピベリジル、3-ピベリジル、4-ピベリジル、ピペラジノ、2-ピペラジニル、2-モルホリニル、3-モルホリニル、モルホリノ、テトラヒドロピラニル等が挙げられる。特に、モルホリノ、ピロリジノ、ピベリジノ、ピペラジノが好ましい。

5

「置換されていてもよいアルキレン」「置換されていてもよいアルキル」、「置換されていてもよいアルケニル」、「置換されていてもよいアルキニル」、「置換されていてもよい炭素環式基」、「置換されていてもよい複素環式基」、「ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよいアルキル」、「ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環」が置換基を有する場合、それ同一または異なる1～4個の置換基で任意の位置が置換されていてもよい。

置換基としては、例えば、ヒドロキシ、カルボキシ、ハロゲン（フッ素、塩素、臭素、よう素）、ハロゲン化アルキル（例えば、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CCl}_3$ 等）、アルキル（例えば、メチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル等）、アルケニル（例えば、ビニル）、ホルミル、アシル（例えば、アセチル、プロピオニル、ブチリル、ビバロイル、ベンゾイル、ピリジンカルボニル、シクロヘンタンカルボニル、シクロヘキサンカルボニル等）、アルキニル（例えば、エチニル）、シクロアルキル（例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロヘンチル、シクロヘキシル等）、シクロアルケニル（例えば、シクロプロペニル等）、アルコキシ（例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ等）、アルコキシカルボニル（例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル等）、ニトロ、ニトロソ、オキソ、置換されていてもよいアミノ（例えば、アミノ、アルキルアミノ（例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、ジメチルアミノ等）、ホルミルアミノ、アシルアミノ（例えば、アセチルアミノ、ベンゾイルアミノ等）、アラルキルアミノ（例えば、ベンジルアミノ、トリチルアミノ））、

ヒドロキシアミノ、アルキルスルホニルアミノ、アルケニルオキシカルボニルアミノ、アルコキシカルボニルアミノ、アルケニルアミノ、アリールカルボニルアミノ、ヘテロアリールカルボニルアミノ等)、アジド、アリール(例えば、フェニル等)、アリールオキシ(例えば、フェノキシ)、アラルキル(例えば、ベンジル、フェネチル、フェニルプロピル等)、アルキレンジオキシ(例えば、メチレンジオキシ)、アルキレン(例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン等)、アルケニレン(例えば、プロペニレン、ブテニレン、ブタジエニレン等)、シアノ、イソシアノ、イソシアナト、チオシアナト、イソチオシアナト、メルカブト、アルキルチオ(例えば、メチルチオ、エチルチオ等)、アルキルスルホニル(例えば、メタンスルホニル、エタンスルホニル)、アリールスルホニル(例えば、ベンゼンスルホニル等)、置換されていてもよいカルバモイル、スルファモイル、ホルミルオキシ、ハロホルミル、オキザロ、メルカブト、チオホルミル、チオカルボキシ、ジチオカルボキシ、チオカルバモイル、スルフィノ、スルフォ、スルホアミノ、ヒドラジノ、ウレイド、アミジノ、グアニジノ、アルキルスルホニルオキシ、トリアルキルシリルオキシ、ハロゲン化アルコキシカルボニルオキシ、ホルミルオキシ、アシルチオ、チオキソ等が挙げられる。

なお、置換基がアルキレン、アルケニレン又はアルキレンジオキシ等の2価の基である場合は、同一の原子にアルキレン等が置換している場合はいわゆるスピロ化合物を形成し、異なる原子にアルキレンが置換している場合は縮合環を形成する。

Y<sup>1</sup>及びY<sup>3</sup>の「置換されていてもよいアルキレン」の置換基としては、例えば、ハロゲン、アルケニレン、ヒドロキシ、アジド、置換されていてもよいアミノ(例えば、アミノ、アシルアミノ、アルキルスルホニルアミノ、アルケニルオキシカルボニルアミノ、アルコキシカルボニルアミノ、アルケニルアミノ、アリールカルボニルアミノ、ヘテロアリールカルボニルアミノ)、シアノ、アルコキシ、ア

ルキルスルホニルオキシ、トリアルキルシリルオキシ、オキソ、メチレン、ハロゲン化アルコキシカルボニルオキシ、ホルミルオキシ又はアシルチオが好ましい。

R<sup>a</sup>及びR<sup>b</sup>の「置換されていてよいアルキル」、「置換されていてよいアルケニル」「置換されていてよいアルキニル」の置換基としては、例えば、ヒドロキシ又はアラルキルが好ましい。

「置換されていてよい炭素環式基」「置換されていてよい複素環式基」の好ましい置換基としては、カルボキシ、置換されていてよいアミノ（例えば、アミノ、アルキルアミノ（例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、ジメチルアミノ等）、アシルアミノ（例えば、アセチルアミノ、ベンゾイルアミノ等）、アラルキルアミノ（例えば、ベンジルアミノ、トリチルアミノ）、ヒドロキシアミノ等）、アルコキシ（例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ等）、アルキルチオ（例えば、メチルチオ、エチルチオ等）、アルキレン（例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン等）、アルキレンジオキシ（例えば、メチレンジオキシ等）、ハロゲン（フッ素、塩素、臭素、よう素）、アルキル（例えば、メチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル等）、ヒドロキシ、オキソ、チオキソ等が挙げられる。

R<sup>a</sup>の「置換されていてよい炭素環式基」としては、置換されていてよいアリール（置換基としては、カルボキシ、置換されていてよいアミノ、アルコキシ、アルキルチオ、アルキレンジオキシ、ハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン化アルキル及び／又はハロゲン化アルコキシ）、置換されていてよいシクロアルキル（置換基としては、アリール及び／又はヒドロキシ）、置換されていてよいシクロアルケニル（置換基としては、アルケニレン、ヒドロキシ、アルキルスルホニルオキシ、アジド、アミノ及び／又はアシルアミノ）が好ましい。

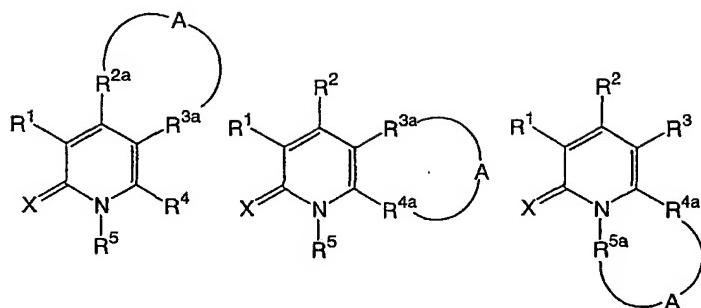
$R^{\alpha}$ の「置換されていてもよい複素環式基」としては、置換されていてもよいヘテロアリール（置換基としては、オキソ、ヘテロアリール、ハロゲン、アリール及び／又はアルキル）又は置換されていてもよいヘテロサイクル（置換基としては、ハロゲンで置換されていてもよいアリール、アラルキル、アシル、アリールカルボニル、シクロアルキルカルボニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アルキル及び／又はハロゲン化アルキルカルボニル）が好ましい。

「ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい環」上の好ましい置換基としては、オキソ、ヒドロキシ、アルケニレン（例えば、プロペニレン、ブチニレン、ブタジエニレン）、アシル（例えば、アセチル、プロピオニル、ブチリル、ビバロイル、ベンゾイル、ピリジンカルボニル、シクロペンタンカルボニル、シクロヘキサンカルボニル等）、アラルキル（例えば、ベンジル等）、アルキレン（例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペントメチレン等）等が挙げられる。

15

$R^5$ の「ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよいアルキル」の置換基としては、ハロゲン、ヒドロキシ、アジド、アミノ、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキルスルホニルオキシ、アシルチオ、アシルアミノ、アリールカルボニルアミノ、シクロアルキルカルボニルアミノ、ハロゲン化アルキルカルボニルアミノ、アルキルスルホニルアミノ、アリールスルホニルアミノ、ホルミル、オキソ又はシアノが好ましい。

「 $R^2$ 及び $R^3$ の組合わせ、 $R^3$ 及び $R^4$ の組合わせ、 $R^4$ 及び $R^5$ の組合わせのいずれか一つの組合わせが一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成する」とは、具体的には以下に示す構造を意味する。

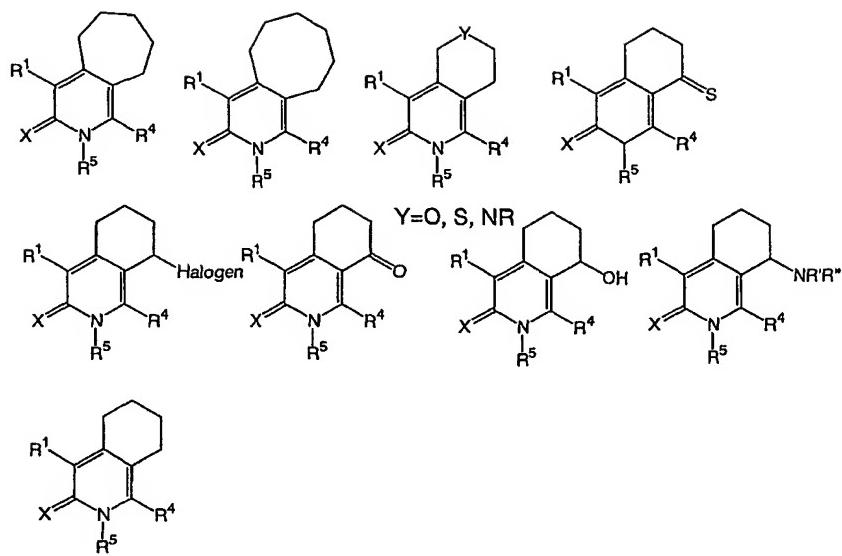


(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記と同意義であり；-R<sup>2a</sup>-A-R<sup>3</sup>  
a-、-R<sup>3a</sup>-A-R<sup>4a</sup>-、-R<sup>4a</sup>-A-R<sup>5a</sup>-はそれぞれ独立してヘテロ原  
子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよいアルキレン  
5 である。)

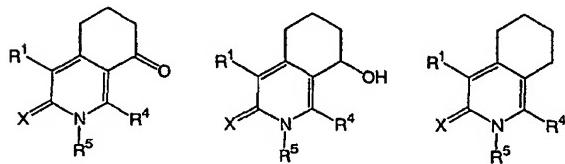
特に、ピリドン環と結合している原子が炭素である場合、すなわちR<sup>2a</sup>、R<sup>3</sup>  
a、R<sup>4a</sup>、R<sup>5a</sup>が炭素原子である場合が好ましい。なお、この炭素原子にも上述  
の置換基（例えば、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシ、オキソ、ハロゲン、ア  
ミノ等）が結合していてもよい。

10 「環」は、4～12員の環を意味し、特に5～10員の環、さらには5～8員  
の環が好ましい。環を構成する原子としては、炭素原子、ヘテロ原子（窒素原子、  
硫黄原子、酸素原子）、水素原子等が挙げられる。

R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>が一緒にになって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和  
15 結合が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成する場合、例えば、以  
下の化合物が挙げられる。



特に好ましいのは下記の化合物である。



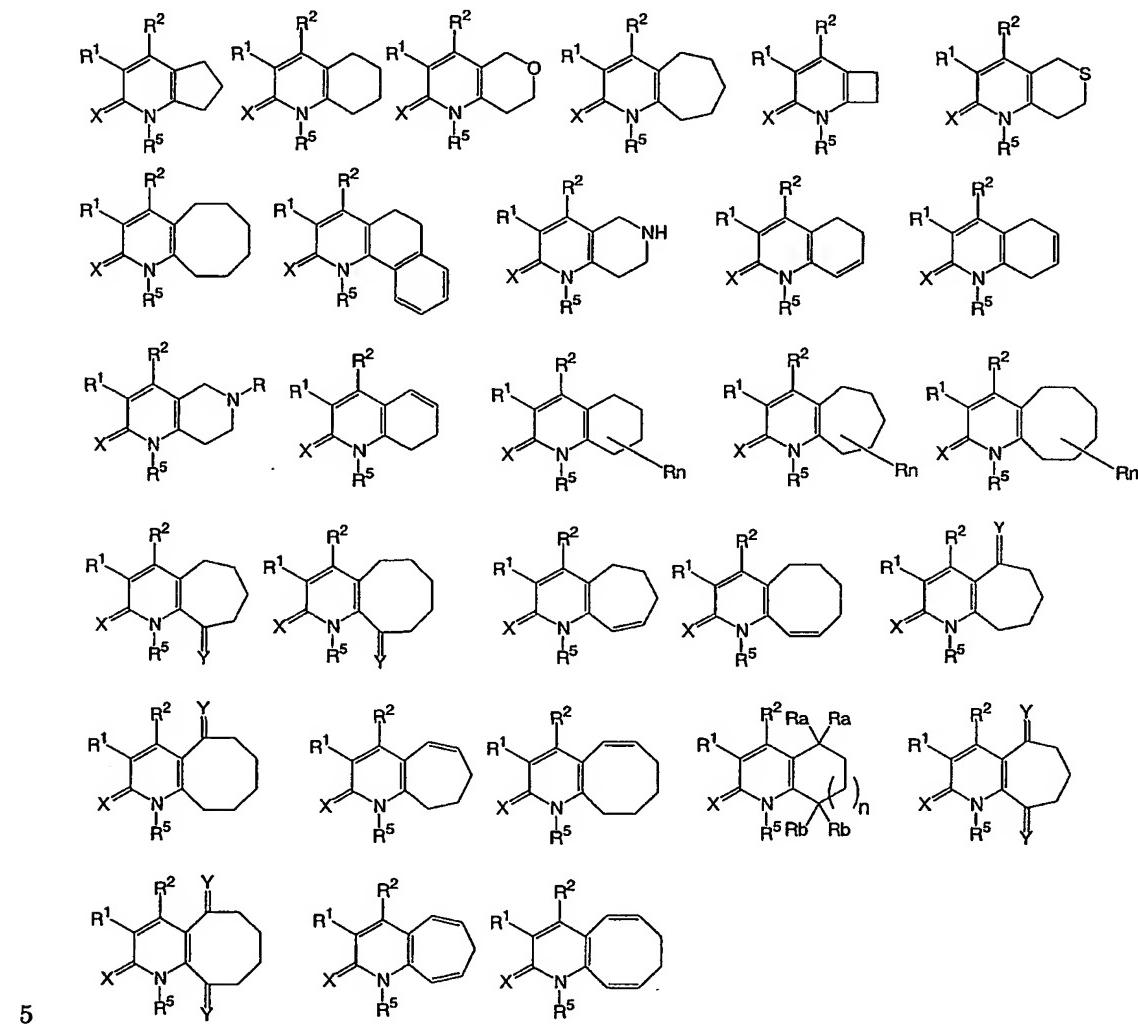
- (R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>及びXは前記と同意義；Yは酸素原子、硫黄原子又は-NR-；  
5 R、R'及びR''は水素、アルキル、アラルキル等)

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子（特に、酸素原子、窒素原子）及び／又は不飽和結合（特に、二重結合）が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成する場合、特に以下の化合物が好ましい。

- 10 1) 該環が非置換炭素環である場合、  
2) 該環の異なる位置がアルケニレンで置換されている場合、  
3) 該環が酸素原子又は窒素原子が介在した環である場合、  
4) 該環が窒素原子が介在した環であり、該窒素原子が置換基（特にアルキル、アシル、アラルキル等）で置換されている場合、  
15 5) 該環が非置換炭素環（但し、R<sup>3</sup>が置換している炭素原子とR<sup>4</sup>が置換している炭素原子間の結合のみが二重結合であり、他の炭素原子間の結合は単結合である）である場合、

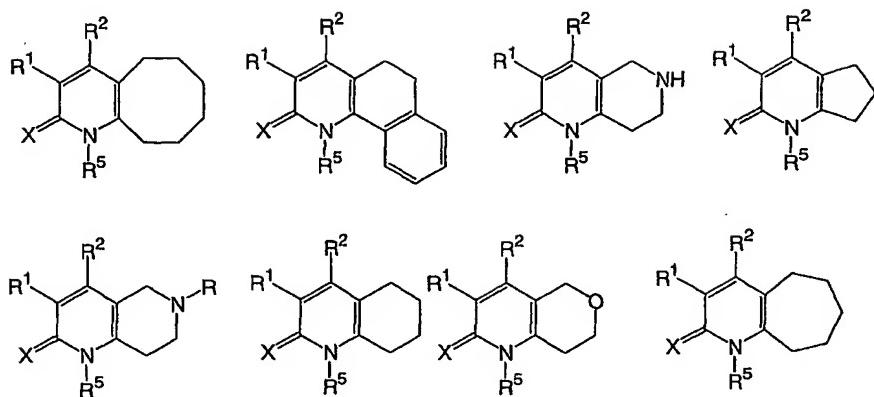
6) 該環がヘテロ原子が介在した非置換の環（但し、R<sup>3</sup>が置換している炭素原子とR<sup>4</sup>が置換している炭素原子間の結合のみが二重結合であり、他の原子間の結合は単結合である）である場合。

例えば、以下の化合物が挙げられる。



5

特に好ましいのは下記の構造である。



(R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>5</sup>、Xは前記と同意義；Yは酸素原子又は硫黄原子；R、Ra及びRbはアシル、アラルキル、アルキル、アルコキシ、オキソ等；nは0～5の整数)

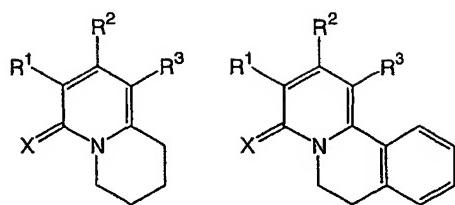
5

なお、本発明にはR<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共に不飽和結合が介在した炭素環を形成する場合も包含される。この場合、不飽和結合としては二重結合が好ましく、R<sup>3</sup>が置換している炭素原子とR<sup>4</sup>が置換している炭素原子間の二重結合以外に、さらに一つの二重結合を有する場合が好ましい。

10 R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共にベンゼン環を形成する場合も本発明に包含される。但しこの場合、該ベンゼン環がジアルコキシで置換されていて、かつR<sup>5</sup>が水素又はメチルである化合物は除く。

15 R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>が一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子（特に、酸素原子、窒素原子）及び／又は不飽和結合（特に、二重結合）が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成する場合、特に以下の化合物が好ましい。

- 1) 該環が不飽和結合（特に、二重結合）が介在していてもよい置換されていてもよい炭素環である場合、
- 2) 該環が非置換の場合、
- 20 3) 該環の異なる位置が置換基（特に、アルケニレン等）で置換されている場合が好ましい。例えば、以下の化合物が挙げられる。



なお、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>の組合わせ、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>の組合わせ、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>の組合わせのうち、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>の組合わせがヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在して  
5 いてもよい置換されていてもよい環である場合が好ましい。

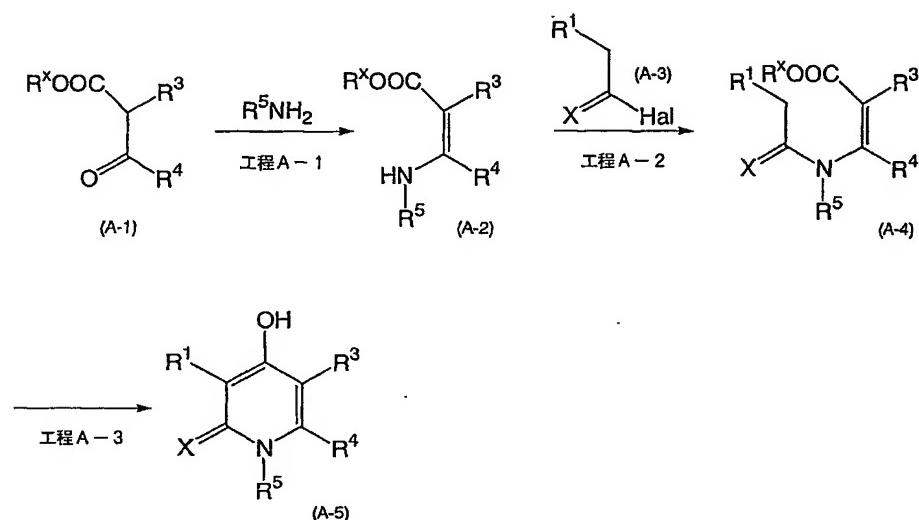
R<sup>1</sup>が式：—Y<sup>1</sup>—Y<sup>2</sup>—Y<sup>3</sup>—R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Y<sup>3</sup>及びR<sup>a</sup>は前記と同意義である）で示される基である場合、特に、式：—Y<sup>1</sup>—Y<sup>2</sup>—Y<sup>3</sup>—R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>は単結合であり；Y<sup>2</sup>は—O—、—NR<sup>b</sup>—C(=O)—又は—C(=O)—  
10 NR<sup>b</sup>—であり；Y<sup>3</sup>は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル又は置換されていてもよいヘテロアリールである）で示される基が好ましい。

「R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になっていない」とは、一緒になって、隣接する原子と共に  
15 ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成していないことを意味し、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>はそれぞれ独立して、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換  
20 されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式：—Y<sup>5</sup>—R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、—O—、—S—、—SO—、—SO<sub>2</sub>—、—NH—、  
—C(=O)—、—CH<sub>2</sub>—、—C(=O)NH—E—又は—NH—C(=O)

ーであり；Eは単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>d</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基である場合を意味する。

## 5 発明を実施するための最良の形態

以下に一般的製法を記載する。



(式中、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^5$ 及び $\text{X}$ は前記と同意義； $\text{R}^x$ はアルキル等；Halはハロゲン)

### 10 工程 A-1

式 (A-1) で示される化合物と式 :  $\text{R}^5\text{NH}_2$  (式中、 $\text{R}^5$ は前記と同意義) で示される化合物を反応させ、式 (A-2) で示される化合物を製造する工程である。式 (A-1) で示される化合物の例としては、エチル アセトアセテート、エチル 2-メチルアセトアセテート、エチル 2-エチルアセトアセテート等が挙げられる。式 : 15  $\text{R}^5\text{NH}_2$  で示される化合物の例としては、アルキルアミン（例えば、メチルアミン、エチルアミン、n-ブロピルアミン、n-ブチルアミン等）、アラルキルアミン（例えば、ベンジルアミン、フェネチルアミン等）等が挙げられる。反応溶媒としては、ベンゼン、トルエン、キシレン等が挙げられ、特にトルエン、キシレンが好ましい。反応温度は、室温～200°C、特に好ましくは80～180°C

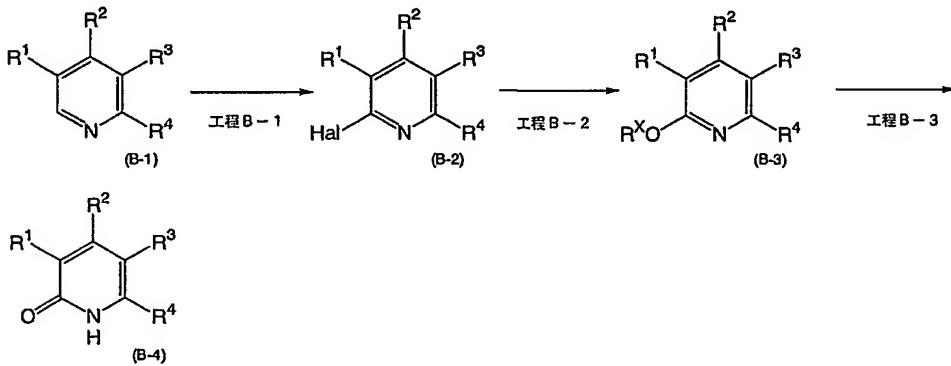
である。本工程は共沸脱水することにより行うことができ、生成物である式 (A-2) で示される化合物は減圧又は常圧下で蒸留等することにより精製することができる。

#### 工程 A - 2

- 5 式 (A-2) で示される化合物と式 (A-3) で示される化合物を塩基の存在下で反応させ、式 (A-4) で示される化合物を製造する工程である。塩基としては、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン等が挙げられ、特にピリジンが好ましい。反応溶媒としては、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、塩化メチレン、トルエン等が挙げられ、特にジエチルエーテルが好ましい。反応温度  
10 は、0～200°C、特に好ましくは室温～100°Cである。

#### 工程 A - 3

- 式 (A-4) で示される化合物を塩基の存在下閉環させ、式 (A-5) で示される化合物を製造する工程である。塩基としては、金属ナトリウム、金属アルコキシド（例えば、ソジウムメトキサイド等）が使用される。反応溶媒としては、アルコール（例えば、メタノール、エタノール）とベンゼン又はトルエン等との混合溶媒が好ましい。反応温度は、0～200°C、特に好ましくは室温～100°Cである。



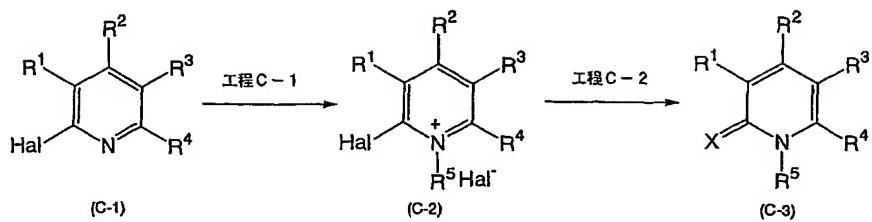
- 20 (式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> は前記と同意義；R<sup>x</sup> はアルキル等を意味する)

#### 工程 B - 1

式 (B-1) で示される化合物にハロゲン化試薬を反応させ、式 (B-2) で示され

- る化合物を製造する工程である。ハロゲン化試薬としては、塩素（ガス）、臭素、沃素等が挙げられるが、特に沃素が好ましい。本工程は、酸の存在下で行うのが好ましい。酸としては、塩酸（濃塩酸、希塩酸）、臭酸、硫酸等が挙げられる。また、塩基の存在下で行うこともできる。塩基としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等を使用することができる。また本工程は、各ハロゲンのカリウム塩の存在下で行うことができる。例えばハロゲン化試薬として沃素を使用した場合は、沃化カリウムの存在下で行うのが好ましい。反応溶媒としては、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等が挙げられる。反応温度は、-10～150°C、特に室温～100°Cが好ましい。
- 10 なお、ハロゲン化試薬としては、N-ハロゲノサクシンイミドを使用することもできる。N-クロロサクシンイミド、N-プロモサクシンイミド等が挙げられ、特にN-プロモサクシンイミドが好ましい。反応溶媒としては、ベンゼン、トルエン、キシレン、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等が挙げられる。
- 工程 B - 2
- 15 式 (B-2) で示される化合物にナトリウムアルコラートを反応させて、式 (B-3) で示される化合物を製造する工程である。ナトリウムアルコラートとしては、ナトリウムメトキサイド、ナトリウムエトキサイド等が挙げられ、特にナトリウムメトキサイドが好ましい。反応溶媒としては、アルコール（例えば、メタノール、エタノール等）が好ましい。反応温度は、0～200°C、特に室温～170°Cが好ましい。本工程は、封管中で加温して行うのが好ましい。
- 20 工程 B - 3

式 (B-3) で示される化合物をビリジニウムクロライドの存在下で加熱して、式 (B-4) で示される化合物を製造する工程である。反応溶媒はなくてもよく、ビリジニウムクロライドを反応溶媒として使用してもよい。反応温度としては、80～250°C、特に100°C～210°Cが好ましい。なお、本工程は、ボロン トリプロマイドを用いても行うことができる。この場合、反応溶媒としては塩化メチレン等を用いることができる。



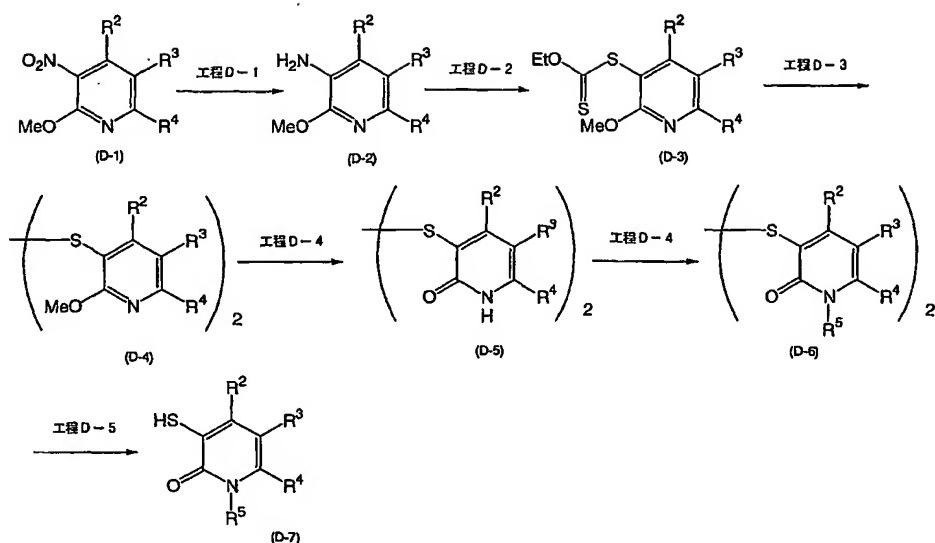
(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記と同意義であり；Halはハロゲンを意味する)

##### 5 工程 C-1

式 (C-1) で示される化合物にR<sup>5</sup>Hal (式中、R<sup>5</sup>は前記と同意義；Halはハロゲン) で示される化合物を反応させ、式 (C-2) で示される化合物を製造する工程である。反応温度は、0～200°C、好ましくは、100～150°Cである。反応溶媒は使用しなくてもよい。封管中で行うことが好ましい。

##### 10 工程 C-2

式 (C-2) で示される化合物から式 (C-2) で示される化合物を製造する工程である。XがSである化合物を製造するときは、1,3-ジフェニルチオ尿素を反応させればよい。反応溶媒としては、アセトニトリル、トルエン、塩化メチレン等を使用することができる。反応温度は、室温～100°C、特に加熱還流下で行うのが好ましい。塩基の存在下で行うのが好ましく、塩基としては、トリエチルアミン等を使用することができる。



(式中、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記と同意義である)

#### 工程 D - 1

式 (D-1) で示される化合物から式 (D-2) で示される化合物を製造する工程である。通常の水素添加反応（接触還元）を行えばよい。触媒としては、パラジウム炭素、酸化白金、二酸化パラジウム等を使用することができる。反応溶媒としては、アルコール（メタノール、エタノール）を使用することができる。反応温度としては、室温が好ましい。なお、本還元は、常圧でも中圧でも行うことができる。

#### 10 工程 D - 2

式 (D-2) で示される化合物のジアゾ化を行い、次いでチオカルボニル化することにより、式 (D-3) で示される化合物を製造する工程である。ジアゾ化は -40 ~ 20 °C (好ましくは 0 °C ~ 10 °C) で行えばよく、酸性条件下で行うことにより、ジアゾニウム塩を得ることができる。なお、反応溶媒としては水、アルコール（メタノール等）が好ましい。得られたジアゾニウム塩のチオカルボニル化は、エチル キサントゲン酸カリウムを反応させて行えばよく、反応は水中で行うことが好ましい。なお、反応温度は、室温 ~ 80 °C、特に 40 °C が好ましい。

#### 工程 D - 3

式 (D-3) で示される化合物を塩基の存在下で反応させ、次にジメチルスルホキ

シドで酸化することにより、式 (D-4) で示される化合物を製造する工程である。塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等が挙げられ、特に水酸化ナトリウムが好ましい。反応溶媒としては、アルコール（例えば、エタノール、プロパノール、ブタノール等）、テトラヒドロフラン等が挙げられ、  
5 特にエタノールが好ましい。反応温度は、0～60°C、特に室温が好ましい。

#### 工程 D - 4

式 (D-4) で示される化合物をヒリジニウムクロライドの存在下で加熱して、式 (D-5) で示される化合物を製造する工程である。本工程は、工程 B - 3 と同様に行なうことができる。

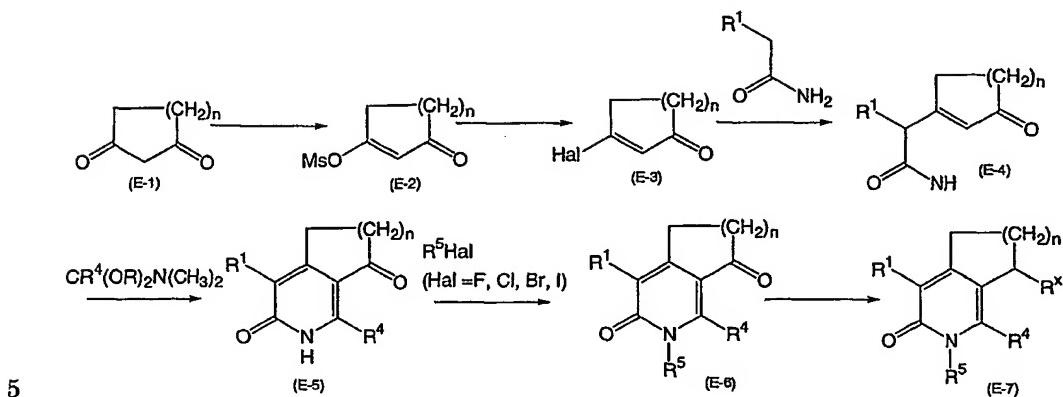
#### 10 工程 D - 5

式 (D-5) で示される化合物に式 : R<sup>5</sup>H a 1 (式中、R<sup>5</sup>は前記と同意義；H a 1 はハロゲン) で示される化合物を塩基存在下で反応させて、式 (D-6) で示される化合物を製造する工程である。塩基として、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、DBU 等を使用した場合は、反応溶媒として、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、アルコール（例えば、メタノール、エタノール、n-ブタノール）等を使用することができる。また、塩基として、水素化ナトリウム、水素化リチウム等（好ましくは、水素化ナトリウム）を使用した場合は、反応溶媒として、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン等を使用することができる。式 : R<sup>5</sup>H a 1 で示される化合物としては、ハロゲン化アルキル（例えば、沃化メチル、沃化エチル、沃化プロピル、沃化ブチル等）、ハロゲン化アラルキル等（例えば、ベンジルプロマイド、フェネチルプロマイド等）等を使用することができる。反応温度は、0～200°C、好ましくは室温～150°C である。

#### 工程 D - 6

25 式 (D-6) で示される化合物を還元して、式 (D-7) で示される化合物を製造する工程である。本工程はトリアルキルホスフィン（例えば、トリ n-ブチルfosfin）又はトリフェニルホスフィン等の存在下で行えばよい。反応溶媒として

は、含水の有機溶媒（アセトン、テトラヒドロフラン、トルエン、塩化メチレン等）を使用することができる。反応温度は、0～150°C、特に室温～100°Cが好ましい。



5

（式中、R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記と同意義であり；nは1以上であり；Halはハロゲンを意味する）

### 工程 E - 1

式 (E-1) で示される化合物にメタンスルホニルハライド（例えば、メタンスル  
10 ホニルクロライド）を反応させ、式 (E-2) で示される化合物を製造する工程である。反応溶媒としては、塩化メチレン、トルエン、テトラヒドロフランが挙げられ、特に塩化メチレンが好ましい。反応温度は、0～150°C、特に室温から1  
00°Cが好ましい。

### 工程 E - 2

式 (E-2) で示される化合物にベンジルトリアルキルアンモニウム ハライドを  
15 ボロントリフルオライドエーテル錯体 (BF<sub>3</sub> · Et<sub>2</sub>O) 存在下で反応させ、式 (E-  
3) で示される化合物を製造する工程である。ベンジルトリアルキルアンモニウム  
ハライドとしては、ベンジルトリエチルアンモニウム クロライド、ベンジルトリ  
20 プチルアンモニウム クロライド等が挙げられ、特にベンジルトリエチルアンモニ  
ウム クロライドが好ましい。反応温度は、0～80°C、特に室温が好ましい。反  
応溶媒としては、塩化メチレン、トルエン等を使用することができる。ボロント

リフルオライドエーテル錯体 ( $\text{BF}_3 \cdot \text{Et}_2\text{O}$ ) の変わりに、TMS トリフレート等を使用することもできる。

#### 工程 E - 3

式 (E-3) で示される化合物に式 :  $\text{R}^1\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$  を塩基存在下で反応させ、式 (E-4) で示される化合物を製造する工程である。塩基としては、水素化リチウム、水素化ナトリウム等が挙げられ、特に水素化ナトリウムが好ましい。反応溶媒としては、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、トルエン、ジグライム等が挙げられ、特にジグライムが好ましい。反応温度は、0 ~ 150 °C、特に室温 ~ 100 °C が好ましい。

#### 10 工程 E - 4

式 (E-4) で示される化合物に式 :  $\text{CR}^4(\text{OR})_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$  (式中、 $\text{R}^4$  は、前記と同意義であり ; R はアルキル等を意味する) で示される化合物を反応させ、式 (E-5) で示される化合物を製造する工程である。式 :  $\text{CR}^4(\text{OR})_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$  で示される化合物としては、N,N-ジメチルホルムアミド ジメチル アセタール、N,N-ジメチルホルムアミド ジエチル アセタール、N,N-ジメチルホルムアミド ジプロピル アセタール、N,N-ジメチルアセトアミド ジブチル アセタール等が挙げられる。反応溶媒としては、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフランを使用することができる。反応温度は、0 ~ 150 °C、好ましくは室温 ~ 100 °C である。

#### 20 工程 E - 5

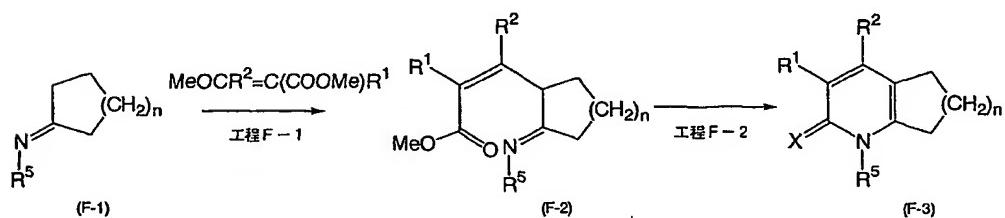
式 (E-5) で示される化合物に式 :  $\text{R}^5\text{Hal}$  (式中、 $\text{R}^5$  は前記と同意義 ; Hal はハロゲン) で示される化合物を塩基の存在下で反応させて、式 (E-6) で示される化合物を製造する工程である。本工程は工程 D - 5 と同様に行うことができる。

#### 25 工程 E - 6

式 (E-6) で示される化合物に還元剤を反応させ、式 (E-7) で示される化合物を製造する工程である。反応溶媒としては、ジエチルエーテル、テトラヒドロフ

ラン、塩化メチレン等が挙げられる。還元剤としてシアノ水素化ほう素ナトリウム、トリアルキルシランを使用した場合は、式 (E-7) (式中、R<sub>x</sub>は水素) で示される化合物を製造することができる。この場合、三ふっ化ほう素ジエチルエーテル錯体の存在下で行ってもよい。還元剤として水素化ほう素ナトリウムを使用した場合は、式 (E-7) (式中、R<sub>x</sub>はヒドロキシ) で示される化合物を製造することができる。

5



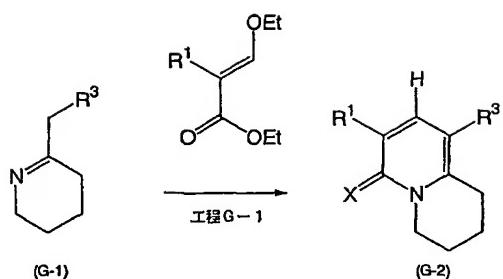
(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及びR<sup>5</sup>は前記と同意義であり；nは1以上である)

#### 10 工程 F - 1

式 (F-1) で示される化合物に式 :  $\text{MeO} \text{C} \text{R}^2 = \text{C} (\text{COOMe}) \text{R}^1$  で示される化合物を反応させ、式 (F-2) で示される化合物を得る工程である。式 :  $\text{MeO} \text{C} \text{R}^2 = \text{C} (\text{COOMe}) \text{R}^1$  で示される化合物としては、メトキシメチレンマロン酸ジメチル、メトキシメチレンマロン酸ジエチル等があげられる。反応溶媒としては、ジグライム、トルエン等が挙げられる。反応温度は、室温～200°C、好ましくは100°C～150°Cである。

#### 工程 F - 2

式 (F-2) で示される化合物を加温して、式 (F-3) で示される化合物を製造する工程である。本工程は、反応溶媒としてジグライム又はトルエンを使用し、室温～200°C、特に100°C～150°Cで行うのが好ましい。なお、工程 F - 1 と工程 F - 2 は連続して、即ち式 (F-2) で示される化合物を単離せずに行ってよい。

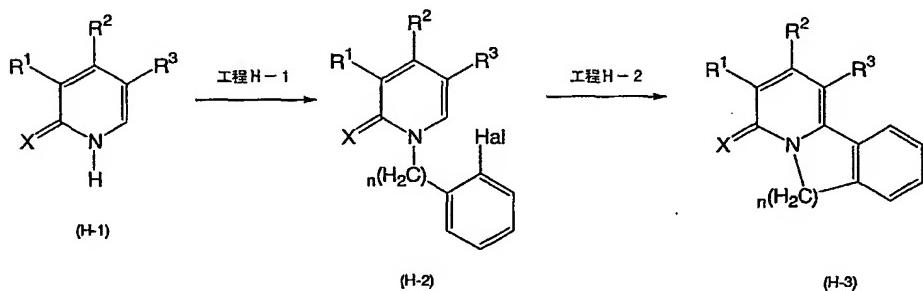


(式中、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $X$ は前記と同意義である)

工程 G - 1

式 (G-1) で示される化合物に式 :  $\text{EtOCH}=\text{C}(\text{COOEt})\text{R}^1$  で示される化合物を反応させ、式 (G-2) で示される化合物を製造する工程である。式 :  $\text{EtOCH}=\text{C}(\text{COOEt})\text{R}^1$  で示される化合物としては、エトキシメチレンマロン酸ジエチル等が挙げられる。反応溶媒としては、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルが好ましい。反応温度は、 $-100^\circ\text{C}$ ～室温、特に $-78^\circ\text{C}$ ～ $0^\circ\text{C}$ が好ましい。塩基としては、LDA、ブチルリチウムを使用することができる。

なお、反応を処理するために、反応終了後、酢酸等で中和してもよい。



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $X$ は前記と同意義であり； $n$ は1以上の整数であり；  
H a lはハロゲンを意味する)

15 工程 H - 1

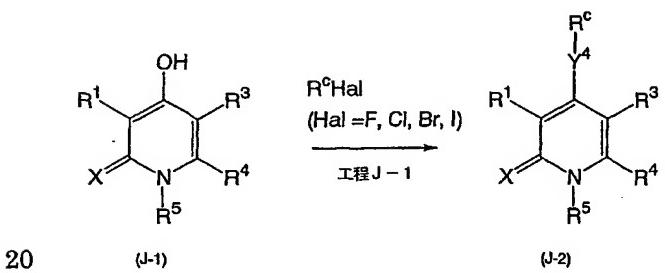
式 (H-1) で示される化合物に o-ハロゲノアラルキルハライドを反応させて、式 (H-2) で示される化合物を製造する工程である。o-ハロゲノアラルキルハライドとしては、o-プロモベンジルプロマイド、o-プロモフェニルプロマイド、o-プロモフェニルプロピルプロマイド等が挙げられる。反応溶媒としては、テトラヒド

ロフラン、ジメチルホルムアミド等が挙げられ、特にジメチルホルムアミドが好ましい。塩基としては、水素化ナトリウム、炭酸カリウム等を使用することができる。なお、反応温度は、0～200°C、特に室温～100°Cが好ましい。

工程 H - 2

- 式 (H-2) で示される化合物をパラジウム触媒、トリフェニルホスフィン、塩基、四級アンモニウム塩の存在下で反応させ、式 (H-3) で示される化合物を得る工程である。パラジウム触媒としては、パラジウムジベンジリデンアセトン（あるいはそのクロロホルム錯体）、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウムを使用することができる。塩基としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、トリエチルアミン等が挙げられ、特に炭酸カリウムが好ましい。特に四級アンモニウムクロリドの存在下で行うのが好ましく、例えば、テトラエチルアンモニウムクロライド、テトラブチルアンモニウムクロライド等が挙げられる。また、その変わりに、リチウムクロライドを使用してもよい。反応溶媒としては、ジメチルホルムアミド、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン等を使用することができる。なお、反応温度としては、0～150°C、特に80°C～130°Cが好ましい。

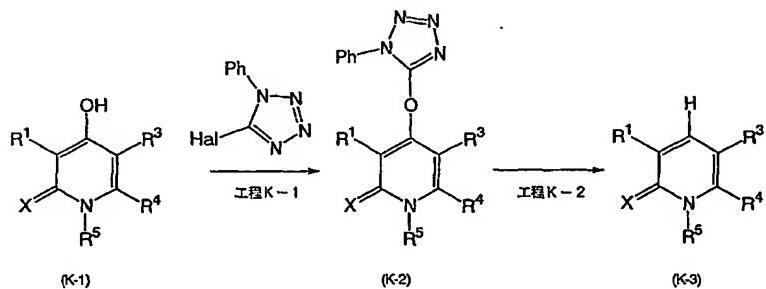
このようにして得られた本発明化合物を以下に示すように官能基変換し、様々な本発明化合物を製造することができる。



工程 J - 1

式 (J-1) で示される化合物と式 : R°H a l (式中、R°は前記と同意義、H a l はハロゲン) で示される化合物を塩基の存在下で反応させ、式 (J-2) で示され

る化合物を製造する工程である。式 : R°Hal で示される化合物の例としては、アルキルハライド（例えば、沃化メチル、沃化エチル）、酸クロライド（例えば、アセチルクロライド、プロピオニルクロライド）、アリールハライド（例えば、プロモベンゼン）、ヘテロアリールハライド（例えば、2-クロロベンゾキサゾール等）、アラルキルハライド（例えば、ベンジルプロマイド、フェネチルプロマイド等）、ヘテロアラルキルハライド（例えば、2-ピコリルクロライド、3-ピコリルクロライド等）、アリールスルホニルハライド（例えば、ベンゼンスルホニルクロライド等）等が挙げられる。塩基としては、水素化リチウム、水素化ナトリウム等が挙げられ、特に水素化ナトリウムが好ましい。反応溶媒としては、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド等が挙げられ、特にジメチルホルムアミドが好ましい。



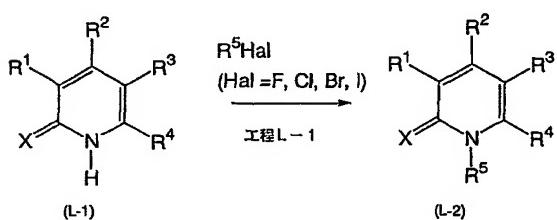
## 工程 K - 1

式 (K-1) で示される化合物とクロロ-1-フェニル-1H-テトラゾールを塩基の存在下で反応させ、式 (K-2) で示される化合物を製造する工程である。塩基としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、水酸化ナトリウム等が挙げられ、特に炭酸カリウムが好ましい。反応溶媒としては、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン等が挙げられ、特にジメチルホルムアミドが好ましい。反応温度としては、0 ~ 100 °C、特に室温が好ましい。

## 工程 K - 2

式 (K-2) で示される化合物を触媒存在下で接触還元し、式 (K-3) で示される化合物を得る工程である。触媒としては、パラジウム炭素、酸化白金等が挙げら

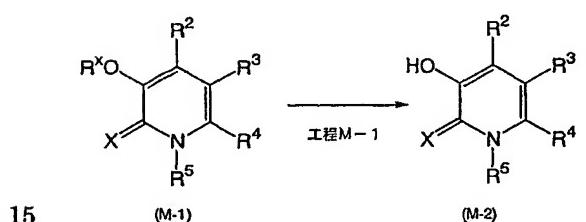
れ、特に 10% パラジウム炭素が好ましい。反応溶媒としては、アルコール（例えば、エタノール）、ジメチルホルムアミド、それらの水との混合溶媒が挙げられ、特にジメチルホルムアミドと水との混合溶媒が好ましい。反応は、常圧で行ってもよく、中圧（例えば、5kg/cm<sup>2</sup>）で行ってもよい。特に、中圧（例えば、5kg/cm<sup>2</sup>）で行うのが好ましい。



（式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記と同意義；H a lはハロゲン）

#### 工程 L - 1

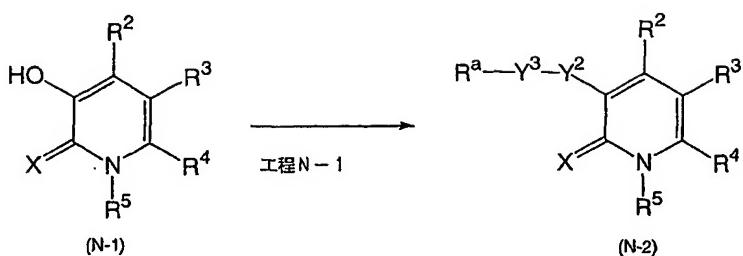
10 式 (L-1) で示される化合物に式 : R<sup>5</sup> H a l（式中、R<sup>5</sup>は前記と同意義；H a lはハロゲン）で示される化合物を塩基の存在下で反応させて、式 (L-2) で示される化合物を製造する工程である。本工程は工程 D - 5 と同様に行なうことができる。



（式中、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>及びXは前記と同意義；R<sup>X</sup>はアルキル等）

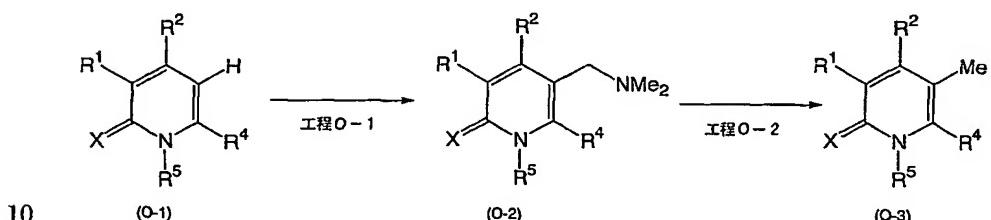
#### 工程 M - 1

15 式 (M-1) で示される化合物をピリジニウムクロライドの存在下で加熱して、式 (M-2) で示される化合物を製造する工程である。工程 B - 3 と同様に行なうことができる。



工程 N - 1

式 (N-1) で示される化合物に各種試薬を反応させて式 (N-2) で示される化合物を製造する工程である。本工程においては、式 (N-1) で示される化合物のフェノール性の水酸基に反応する試薬であれば、いかなる試薬であっても使用することができます。また、必要に応じて塩基、縮合剤、触媒等を使用することができる。反応温度は、反応の種類、使用する試薬、塩基、縮合剤、触媒等によって選択すればよい。



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 及び $R^5$ は前記と同意義)

工程 0-1

式 (O-1) で示される化合物に N,N,N',N'-テトラメチルジアミノメタンを反応させ、式 (O-2) で示される化合物を製造する工程である。反応溶媒としては、トルエン、エタノール、含水エタノールが挙げられ、特に含水エタノールが好ましい。反応温度、室温～100°C、特に 60°C～80°C が好ましい。なお、加熱還流下で行うのが好ましい。

工程 0-2

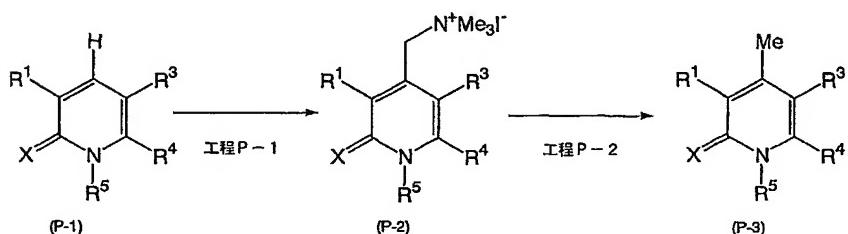
式 (O-2) で示される化合物にハロゲン化アルキルを反応させ、次いでトリフェニルホウ酸ナトリウムと反応させ、最後に水酸化ナトリウムで処理することにより、式

(O-3) で示される化合物を製造する工程である。ハロゲン化アルキルとしては、エチルブロマイド、ヨードメタン等を使用することができる。反応溶媒としては、塩化メチレン、アルコール、トルエンが好ましく、反応温度は室温が好ましい。

トリフェニルホフミンを反応させホスホニウム塩に置換する工程は、反応溶媒としてアルコール（エタノール）、テトラヒドロフランを使用し、反応温度を50～100℃、特に70℃で行うのが好ましい。

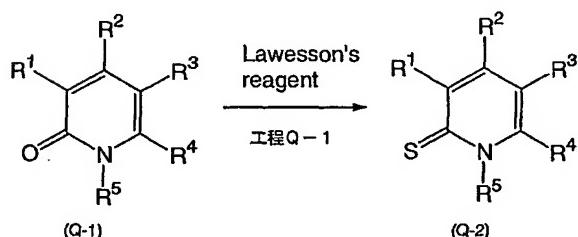
このようにして得られたホスホニウム塩を塩基処理して、メチル体へと誘導できる。塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムを使用することができる。

10



(式中、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 及び $R^5$ は前記と同意義)

式 (P-1) で示される化合物に工程 O-1 と同様に N,N,N',N'-テトラメチルジアミノメタンを反応させ、次いでヨードメタンを反応させることにより、式 (P-2) 15 で示される化合物を得る。さらに工程 O-2 と同様にトリフェニルホスフィン、次いで塩基で処理することにより、式 (P-3) で示される化合物を製造することができる。

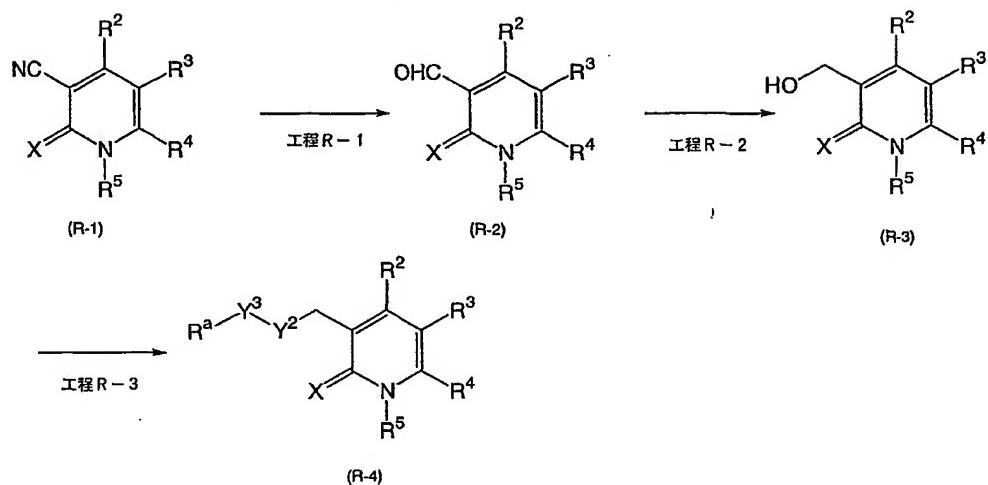


20 (式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 及び $R^5$ は前記と同意義)

工程 Q - 1

式 (Q-1) で示される化合物に Lawesson 試薬を反応させ、式 (Q-2) で示される化合物を製造する工程である。反応溶媒としては、ベンゼン、トルエン、キシレン等が挙げられ、特にトルエンが好ましい。反応温度は、80～250°C、特にトルエン中加熱還流下で反応を行うのが好ましい。

5



(式中、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、X、R<sup>a</sup>、Y<sup>3</sup>及びY<sup>2</sup>は前記と同意義)

#### 工程 R-1

- 式 (R-1) で示される化合物に水素化ジイソブチルアルミニウムを反応させて、  
 10 式 (R-2) で示される化合物を製造する工程である。反応溶媒としては、トルエン、テトラヒドロフラン等を使用することができる。反応は、氷冷下で行うことが好ましい。

#### 工程 R-2

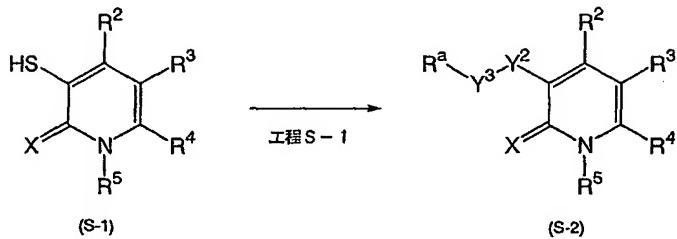
- 式 (R-2) で示される化合物に水素化ほう素化ナトリウムを反応させて、式 (R-3)  
 15 で示される化合物を製造する工程である。反応溶媒としては、アルコール（例えば、エタノール、メタノール等）を使用することができる。反応は室温で行えばよい。

#### 工程 R-3

- 式 (R-3) で示される化合物に各種試薬を反応させて式 (R-4) で示される化合物を製造する工程である。本工程においては、式 (R-3) で示される化合物のアル

コール性の水酸基に反応する試薬であれば、いかなる試薬であっても使用することができます。また、必要に応じて塩基、縮合剤、触媒等を使用することができます。反応温度は、反応の種類、使用する試薬、塩基、縮合剤、触媒等によって選択すればよい。

5

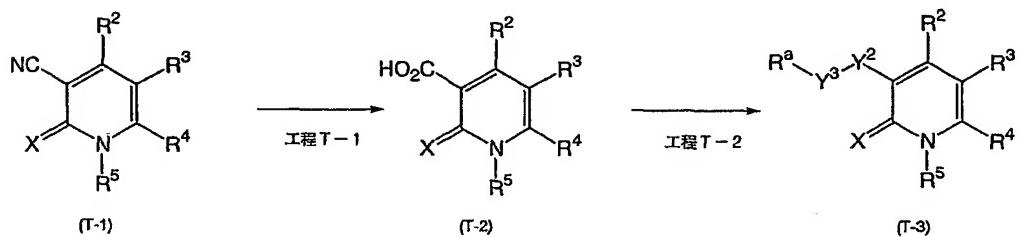


(式中、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>a</sup>、X、Y<sup>2</sup>及びY<sup>3</sup>は前記と同意義)

#### 工程 S - 1

式 (S-1) で示される化合物に各種試薬を反応させて式 (S-2) で示される化合物を製造する工程である。本工程においては、式 (S-1) で示される化合物のメルカブト基に反応する試薬であれば、いかなる試薬であっても使用することができます。また、必要に応じて塩基、縮合剤、触媒等を使用することができます。反応温度は、反応の種類、使用する試薬、塩基、縮合剤、触媒等によって選択すればよい。

15



(式中、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>a</sup>、X、Y<sup>2</sup>及びY<sup>3</sup>は前記と同意義)

#### 工程 T - 1

式 (T-1) で示される化合物を加水分解し、式 (T-2) で示される化合物を製造する工程である。本工程の加水分解には、塩基又は酸を使用することができる。塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムを使用することができる。酸

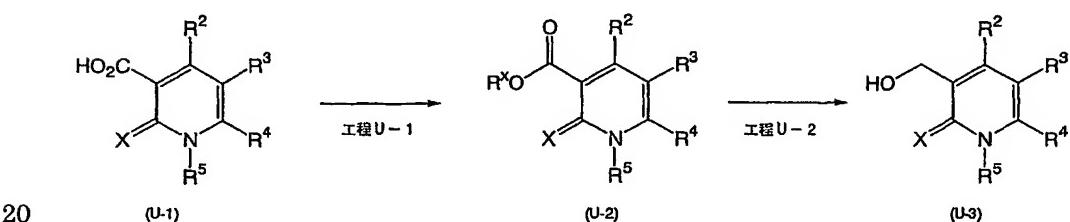
としては、濃塩酸、濃硫酸を使用することができる。反応溶媒としては、エタノール、水、またはそれらの混合溶媒を使用することができる。反応温度は、80～150°C、特に100°Cが好ましい。

工程 T - 2

5 式 (T-2) で示される化合物に各種試薬を反応させて式 (T-3) で示される化合物を製造する工程である。本工程においては、式 (T-2) で示される化合物のカルボキシル基に反応する試薬であれば、いかなる試薬であっても使用することができる。また、必要に応じて塩基、縮合剤、触媒等を使用することができる。反応温度は、反応の種類、使用する試薬、塩基、縮合剤、触媒等によって選択すれば  
10 よい。

例として  $Y^2$  が  $-C(=O)-NH-$  であり、 $Y^3$  がアルキレンであり、 $R^a$  がアリール、ヘテロアリールである場合を以下に説明する。

式 (T-2) で示される化合物にメタンスルホニルクロライドを塩基存在下で反応させ、次いで式 :  $R^a Y^3 N H_2$  で示される化合物を反応させ、式 (T-3) で示される化合物を製造することができる。塩基としては、トリアルキルアミン（例えば、トリエチルアミン）、ピリジン等が挙げられ、特にトリエチルアミンが好ましい。反応溶媒としては、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。反応温度は、 $0^{\circ}C \sim 150^{\circ}C$ 、特に室温～ $100^{\circ}C$ が好ましい。



(式中、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>及びXは前記と同意義；R<sup>X</sup>はメチル、メシル、トリメチルシリル等)

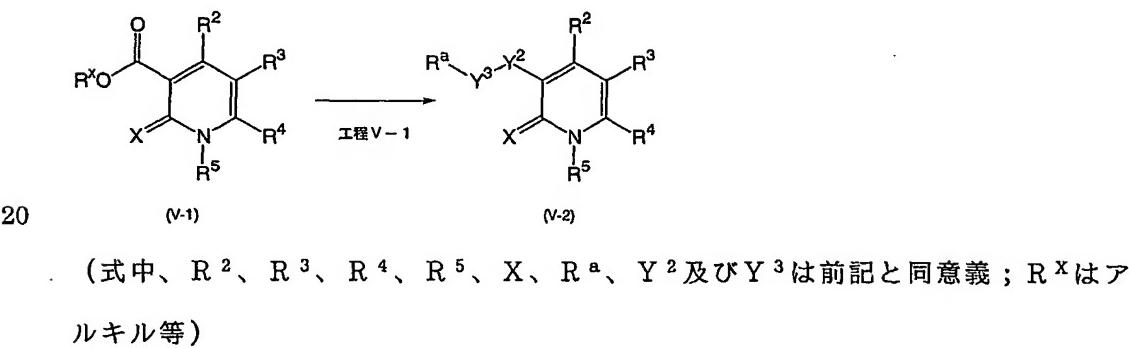
工程 U - 1

式 (U-1) で示される化合物のエステル化を行い、式 (U-2) で示される化合物を製造する工程である。エステルとしては、メチルエステル、メシリエステル、トリアルキルシリルエステル（例えば、トリメチルシリルエステル等）が好ましい。通常のエステル化の条件で行うことができる。

- 5 例えは、トリアルキルシリルエステルを製造する場合は、式 (U-1) で示される化合物にトリアルキルシリルハライドを反応させ、式 (U-2) で示される化合物を製造すればよい。トリアルキルシリルハライドとしては、トリメチルシリルクロライド等が挙げられる。本工程は、ヘキサメチルジシラザンの存在下で行うことが好ましい。反応溶媒としては、ベンゼン、トルエン、キシレン等が挙げられ、  
10 特にトルエンが好ましい。反応温度は、室温～200°C、特にトルエン中加熱還流下で反応を行うのが好ましい。

#### 工程 U - 2

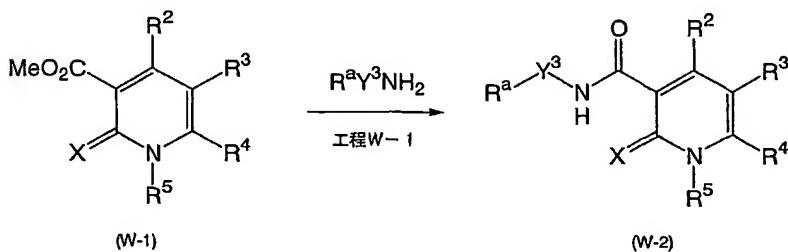
- 式 (U-2) で示される化合物に還元剤を反応させ、式 (U-3) で示される化合物を製造する工程である。還元剤としては、水素化リチウムアルミニウム、水素化リチウム、DIBAL 等が挙げられる。本工程は、塩化セリウムの存在下で行うことができる。反応溶媒としては、アルコール（メタノール、エタノール）、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルを使用することができる。反応温度は、室温が好ましい。



#### 工程 V - 1

式 (V-1) で示される化合物に各種試薬を反応させて式 (V-2) で示される化合

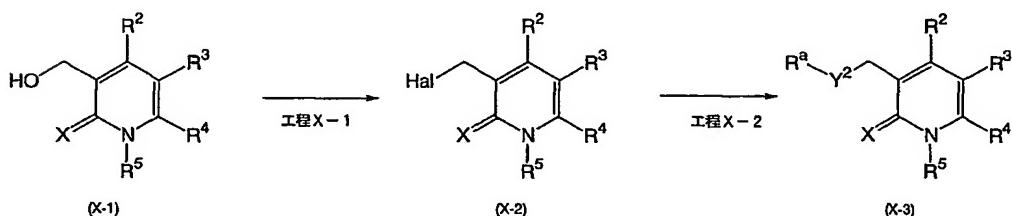
物を製造する工程である。本工程においては、式 (V-2) で示される化合物の式：  
- C (= O) - O R<sup>X</sup> で示される基に反応する試薬であれば、いかなる試薬であっても使用することができる。また、必要に応じて塩基、縮合剤、触媒等を使用することができる。反応温度は、反応の種類、使用する試薬、塩基、縮合剤、触媒等によって選択すればよい。



(式中、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $X$ 、 $R^a$ 及び $Y^3$ は前記と同意義)

工程W-1

10 式 (W-1) で示される化合物に式 :  $R^a Y^3 N H_2$  で示される化合物を反応させ、  
式 (W-2) で示される化合物を製造する工程である。式 :  $R^a Y^3 N H_2$  で示され  
る化合物としては、置換されていてもよいアラルキルアミン（例えば、ベンジル  
アミン、フェネチルアミン、p-アミノフェネチルアミン等）、置換されていても  
よいヘテロアラルキルアミン（例えば、2-(ピリジン-4-イル)エチルアミン等）等  
が挙げられる。反応溶媒としては、キシレン、ジグライム等が挙げられ、特にジ  
グライムが好ましい。反応温度としては、100～250°C、特に150～20  
0°Cが好ましい。



20 (式中、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^a$ 、 $Y^2$ は前記と同意義；H<sub>a</sub>1はハロゲン)

工程 X - 1

式 (X-1) で示される化合物にハロゲン化チオニルを反応させ、式 (X-2) で示される化合物を製造する工程である。ハロゲン化チオニルとしては、臭化チエニル、塩化チオニル等が挙げられる。反応溶媒としては、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等が挙げられ、特に塩化メチレンが好ましい。反応温度は、0  
5 ~ 100°C、特に 10°C~室温が好ましい。

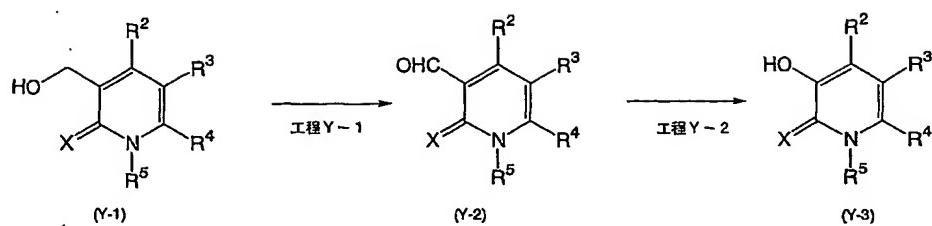
別の方法としては、式 (X-1) で示される化合物に N-ハロゲノサクシンイミドをトリフェニルfosfin の存在下で反応させ、式 (X-2) で示される化合物を製造することもできる。N-ハロゲノサクシンイミドとしては、N-クロロサクシンイミド、N-ブロモサクシンイミド等が挙げられ、特に N-ブロモサクシンイミドが好ましい。反応溶媒としては、ベンゼン、トルエン、キシレン、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等が挙げられる。  
10

#### 工程 X - 2

式 (X-2) で示される化合物に各種試薬を反応させ式 (X-3) で示される化合物を製造する工程である。本工程においては、式 (X-2) で示される化合物のハロゲ  
15 ノメチル基に反応する試薬であれば、いかなる試薬であっても使用することができる。また、必要に応じて塩基、縮合剤、触媒等を使用することができる。反応温度は、反応の種類、使用する試薬、塩基、縮合剤、触媒等によって判断すればよい。

例として、Y<sup>2</sup> が -S- であり、Y<sup>3</sup> が単結合であり、R<sup>a</sup> がアリール、ヘテロ  
20 アリールである場合を以下に説明する。

式 (X-2) で示される化合物にアリールメルカプタン（例えば、ベンゼンチオール等）又はヘテロアリールメルカプタン（例えば、2-メルカプトベンゾキサゾール等）を塩基存在下で反応させ、式 (X-3) で示される化合物を製造することができる。塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等が挙げられ、特に炭酸カリウムが好ましい。反応溶媒としては、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。  
25 反応温度は、0°C~150°C、特に室温~100°Cが好ましい。



(式中、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、Xは前記と同意義)

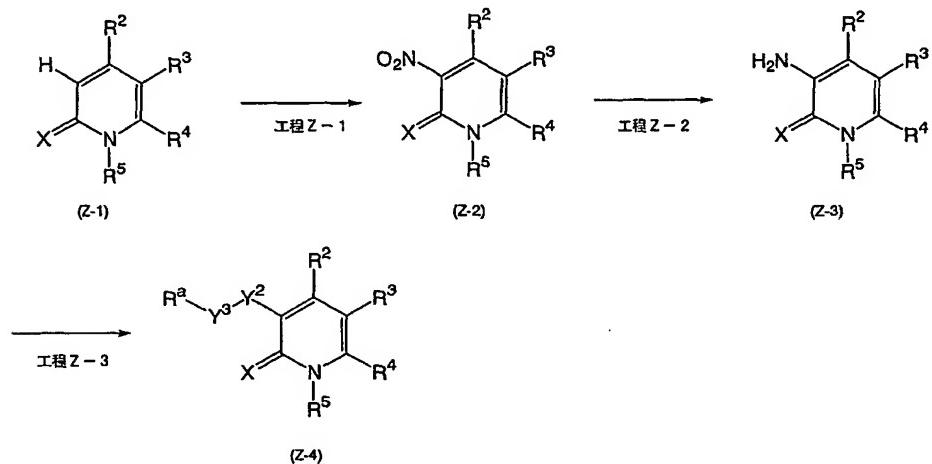
#### 工程 Y - 1

- 式 (Y-1) で示される化合物にジメチルスルホキシド及びオキザリルハライドを  
5 反応させ、スワン酸化を行い、式 (Y-2) で示される化合物を製造する工程である。  
オキザリルハライドとしては、オキザリルクロライド等が挙げられる。反応溶媒  
としては、塩化メチレン等が挙げられる。反応温度は、-78 ~ 0 °C、特に-60 ~ -40 °C が好ましい。

#### 工程 Y - 2

- 10 式 (Y-2) で示される化合物に酸化剤を反応させ、式 (Y-3) で示される化合物  
を製造する工程である。酸化剤としては、メタクロロ過安息香酸等を使用するこ  
とができる。なお、本工程においては、リン酸水素ナトリウムを添加してもよい。  
反応溶媒としては、塩化メチレン、テトラヒドロフラン等を使用することができ  
る。なお、反応は室温で行えばよい。

15



(式中、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、X、R<sup>a</sup>、Y<sup>2</sup>及びY<sup>3</sup>は前記と同意義)

## 工程 Z - 1

式 (Z-1) で示される化合物から式 (Z-2) で示される化合物を製造する工程である。通常のニトロ化反応を行えばよい。例えば、混酸（硫酸及び硝酸）を使用してニトロ化を行えばよい。反応温度、反応溶媒等も通常のニトロ化と同様に選択すればよい。

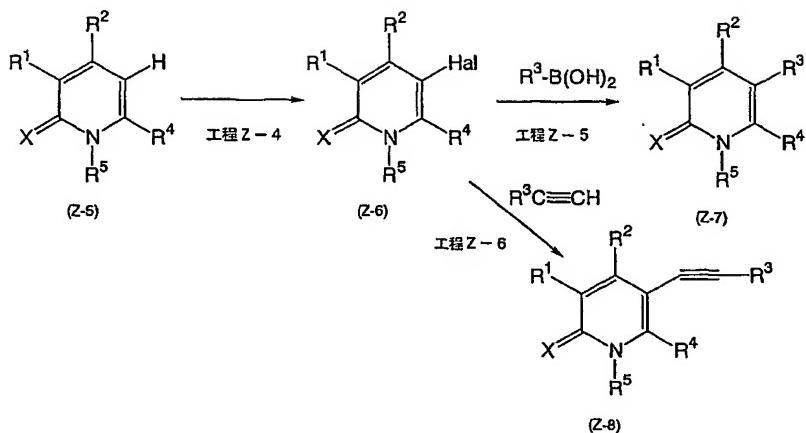
## 工程 Z - 2

式 (Z-2) で示される化合物を還元して式 (Z-3) で示される化合物を製造する工程である。本工程は工程 D - 1 と同様に行うことができる。

## 工程 Z - 3

式 (Z-3) で示される化合物に各種試薬を反応させ式 (Z-4) で示される化合物を製造する工程である。本工程においては、式 (Z-3) で示される化合物のアミノ基に反応する試薬であれば、いかなる試薬であっても使用することができる。また、必要に応じて塩基、縮合剤、触媒等を使用することができる。反応温度は、反応の種類、使用する試薬、塩基、縮合剤、触媒等によって判断すればよい。

例として、Y<sup>2</sup>が -NH-C(=O)- であり、Y<sup>3</sup>が単結合であり、R<sup>a</sup>がアルキル、アリールである場合を以下に説明する。式 (Z-3) で示される化合物にアシル化剤（例えば、アセチルクロライド、ベンゾイルクロライド等）を反応させ、式 (Z-4) で示される化合物を製造することができる。本工程は、塩基存在下で行うのが好ましく、例えば、ピリジン等が使用できる。反応溶媒としては、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。反応温度は、0°C ~ 150°C、特に室温~100°Cが好ましい。



(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>及びXは前記と同意義；Halはハロゲン)

#### 工程 Z - 4

式 (Z-5) で示される化合物に N-ハロゲノサクシンイミドを反応させ、式 (Z-6) 5 で示される化合物を製造する工程である。本工程は、工程 B - 1 と同様に行うことができる。

#### 工程 Z - 5

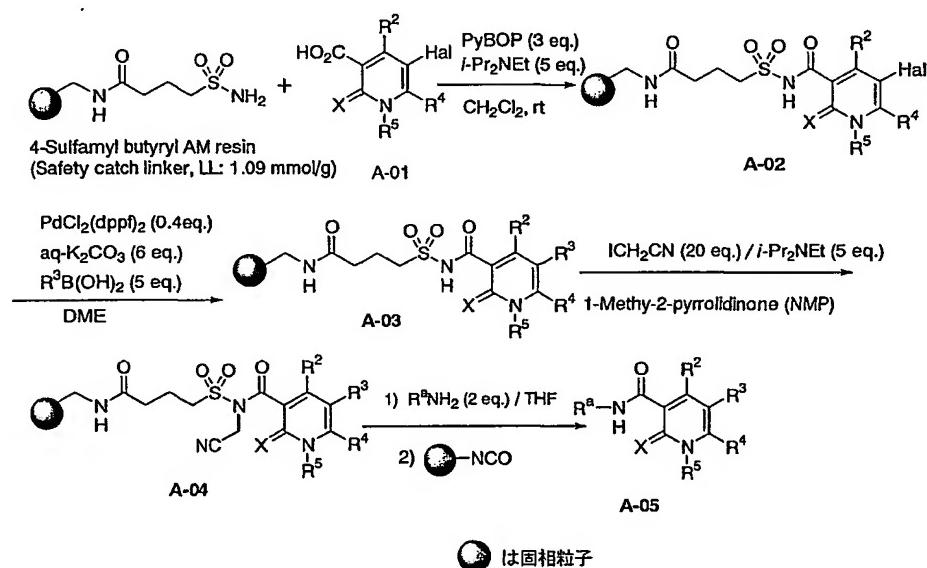
式 (Z-6) で示される化合物に式 : R<sup>3</sup>-B(OH)<sub>2</sub> 10 で示される化合物をパラジウム触媒の存在下で反応させ、式 (Z-7) で示される化合物を製造する工程である。式 : R<sup>3</sup>-B(OH)<sub>2</sub> で示される化合物の R<sup>3</sup> としては、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいアリールアルケニル、置換されていてもよいアリールアルキニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール等が挙げられる。パラジウム触媒としては、Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>、PdCl<sub>2</sub>(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub> 等が挙げられる。本工程は、塩基の存在下で行うのが好ましく、塩基としては、トリエチルアミン、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、ナトリウムアルコラート（例えば、NaOMe、NaOEt 等）等が挙げられる。反応溶媒としては、ジメチルホルムアミド、ベンゼン、トルエン、キシレン等が挙げられ、特にジメチルホルムアミドが好ましい。反応温度としては、室温～200°C、特に50～100°Cが好ましい。

#### 20 工程 Z - 6

式 (Z-6) で示される化合物に式 : R<sup>3</sup>C≡CH で示される化合物をパラジウム

触媒の存在下で反応させ、式 (Z-8) で示される化合物を製造する工程である。式：  
 $R^3C \equiv CH$  で示される化合物の  $R^3$  としては、置換されていてもよいアルケニル、  
 置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいアリールアルケニル、  
 置換されていてもよいアリールアルキニル、置換されていてもよいアリール、置  
 5 換されていてもよいヘテロアリール等が挙げられる。本工程は上記工程 Z-5 と  
 同様に行うことができる。なお、本工程はよう化銅等の存在下で行ってもよい。

本発明化合物を製造するに際し、下記の固相合成を行うことができる。



10 (式中、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  及び  $R^a$  は前記と同意義である。)

### レジン A-02 の合成

レジンにカルボン酸を結合させる工程である。レジンとしては、4-スルファミルブチリル AM レジン等を使用することができる。カルボン酸としては、A-01 で示される化合物を使用することができる。この場合、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  及び X を選択し、使用するカルボン酸を選択することができる。例えば、4-n-ブチル-5-ヨード-2-オキソ-1,2-ジヒドロビリジン-3-カルボン酸 ( $R^2$  及び  $R^4$  が水素、 $R^5$  が n-ブチル、X が酸素である X-1 で示されるカルボン酸) を使用することができる。

反応溶媒としては、塩化メチレン等を使用することができる。反応温度は、室温が好ましい。本工程は、*N,N*-ジイソプロピルエチルアミン及びPyBOPの存在下で行うのが好ましい。反応時間としては、数時間～数十時間、特に十数時間が好ましい。反応終了後、レジンを濾取し、洗浄溶媒（例えば、水、THF、塩化メチレン、エーテル等）で順次洗浄し、レジン(A-02)を製造することができる。

#### レジン(A-03)の合成

上記で得られたレジン A-02 からレジン A-03 を製造する工程である。レジン A-02 に式： $R^3-B(OH)_2$ で示される化合物をパラジウム触媒及び塩基の存在下で反応させ、レジン A-03を得る工程である。反応溶媒としては、DME等が挙げられる。パラジウム触媒としては、 $PdCl_2(dppf)$ 等を使用することができる。式： $R^3-B(OH)_2$ で示される化合物は固相粒子に対して約5当量使用することが望ましい。式： $R^3-B(OH)_2$ で示される化合物としては、 $R^3$ が置換されていもてよいアリール基又は置換されていもてよいアリール基である化合物を使用することができる。この場合、置換基は広く選択することができる。塩基としては、炭酸カリウム等を使用することができる。反応温度としては、約80°Cが好ましい。反応時間としては、数時間～数十時間、特に十数時間が好ましい。反応終了後、レジンを濾取し、洗浄溶媒（例えば、水、THF、*N*-メチルピロリドン、塩化メチレン、エーテル）で順次洗浄し、レジン(A-03)を製造することができる。

#### レジン A-04 の合成

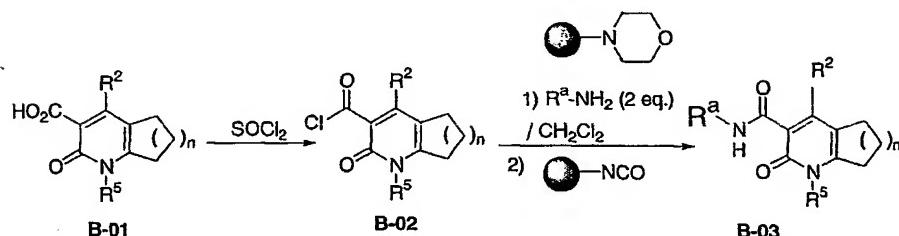
レジン A-03 にヨードアセトニトリルを塩基の存在下で反応させ、レジン A-04 を製造する工程である。反応溶媒としては、*N*-メチルピロリドン等を使用することができます。塩基としては、*N,N*-ジイソプロピルエチルアミン等を使用することができます。反応温度は室温が好ましい。反応時間としては、数時間～数十時間、特に十数時間が好ましい。反応終了後、レジンを濾取し、洗浄溶媒（例えば、*N*-メチルピロリドン、塩化メチレン、エーテル）で順次洗浄し、レジン(A-03)を製造することができる。

### 本発明化合物(A-5)の合成

レジン A-04 にアミンを反応させ、反応終了後固相粒子から化合物を切り出し、本発明化合物(A-5)を製造する工程である。反応溶媒としては、THF 等を使用することができる。本工程においては、各種のアミンを使用することができる。これにより効率よく各種の R<sup>a</sup> を有する本発明化合物を合成することができる。反応は約 24 時間行い、反応終了後、高分子固定化イソシアネート樹脂を加え、数時間振とうし、過剰のアミンを除去した後、固相粒子から化合物(A-05)を切り出すことができる。すなわち、レジンを濾別し、溶出溶媒（例えば、塩化メチレン）で溶出し、濾液を減圧下で留去することにより化合物(A-05)を製造することができる。

10

上記とは別の固相合成として、下記の固相合成を行い、本発明化合物を合成することができる。



(式中、R<sup>2</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>a</sup>は前記と同意義；nは1以上の整数。)

15 化合物(B-02)の合成

化合物(B-01)に塩化チオニルを反応させて、化合物(B-02)を製造する工程である。化合物(B-01)としては、例えば、1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8,9,10-オクタヒドロ-シクロオクタ[b]ピリジン-3-カルボン酸（R<sup>2</sup>が水素、R<sup>5</sup>がn-ブチル）等を使用することができる。反応溶媒としては、トルエン等を使用することができる。

20 反応温度としては、約 65°C が好ましい。反応は比較的短時間で進行し、約 20 分で反応が終了する。この反応液を減圧濃縮することにより、化合物(B-02)を製造することができる。

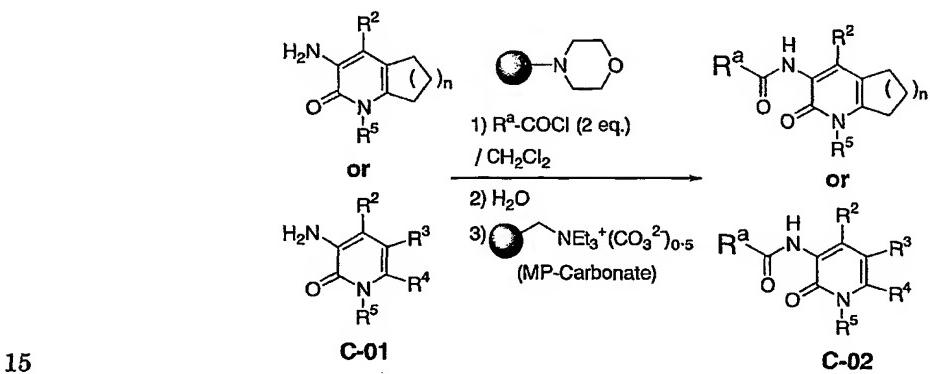
### 化合物(B-03)の合成

高分子固定化 N-メチルモルホリン樹脂(1.93 mmol/g)存在下、アミン(R<sup>a</sup>-NH<sub>2</sub>)

及び化合物(B-02)を反応させることにより、本発明化合物(B-03)を製造する工程である。反応溶媒としては、塩化メチレン等を使用することができる。本工程においては、各種のアミンを使用することができる。これにより効率よく各種のR<sup>a</sup>を有する本発明化合物を合成することができる。反応は約24時間行い、反応終了後、高分子固定化イソシアネート樹脂を加え、数時間振とうし、過剰のアミンを除去した後、化合物(B-03)を得ることができる。すなわち、レジンを濾別し、溶出溶媒(例えば、塩化メチレン)で溶出し、濾液を減圧下で留去することにより化合物(B-03)を製造することができる。

なお、上記においては、 $R^3$ 及び $R^4$ が一緒になって、隣接する原子と共に環を形成する場合を例示しているが、 $R^3$ 及び $R^4$ が一緒になっていない場合であっても本固相合成を行うことができる。

上記とは別の固相合成として、下記の固相合成を行い、本発明化合物を合成することができる。



(式中、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^n$ は前記と同意義；nは1以上の整数。)

## 化合物(C-02)の合成

高分子固定化 *N*-メチルモルホリン樹脂(1.93 mmol/g)存在下、酸クロリド(R<sup>a</sup>-COCl)及び化合物(C-01)を反応させることにより、本発明化合物(C-02)を製造する工程である。反応溶媒としては、塩化メチレン等を使用することができる。本工程においては、各種の酸クロリドを使用することができる。これにより効率よく各種のR<sup>a</sup>を有する本発明化合物を合成することができる。反応は約24時間行い、

- 反応終了後、高分子固定化カーボナート樹脂(MP-Carbonate)を加え、数時間振とうし、過剰のアミンを除去した後、化合物(C-02)を得ることができる。すなわち、レジンを濾別し、溶出溶媒(例えば、塩化メチレン)で溶出し、濾液を減圧下で留去することにより化合物(C-02)を製造することができる。また、これらの生成物を全自動の精製装置等に付すことにより、さらに純度の高い化合物を得ることができる。なお、上記においては、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共に環を形成する場合を例示しているが、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になつてない場合であっても本固相合成を行うことができる。
- 10 なお、これらの固相合成で使用される式：R<sup>3</sup>—B(OH)<sub>2</sub>で示される化合物、式：R<sup>a</sup>NH<sub>2</sub>で示される化合物は、市販の化合物を使用してもよいし、別途合成してもよい。
- 本製法は、固相合成であるため、精製作業としては固相粒子の洗浄を行えばよく、実験操作としてもほとんどルーチンで行うことができ、短期間に各種の置換基を有する多数の化合物を製造することができ、有用である。すなわち、固相合成の利点を生かして、化合物の骨格等を固定し、様々な種類の式：R<sup>3</sup>—B(OH)<sub>2</sub>で示される化合物及び式：R<sup>a</sup>NH<sub>2</sub>で示される化合物を反応させ、数十～数万の化合物の中から最適な置換基を有する化合物を選択することができ、高活性な本発明化合物を見出すことができる。
- 20 また、本製法により得られた化合物の2以上の集合により、本発明化合物のライブラリーを製造することができる。この際、上記のようにスプリット合成を利用してもよいし、上記とは別にパラレル合成で行ってもよい。また、通常の有機合成(例えば、液相合成)で製造された化合物であってもよい。ここで化合物のライブラリーとは、共通の部分構造を有する2以上の化合物の集合を意味する。
- 例えれば、本発明化合物の共通の部分構造としては、ピリドン骨格を有する点を挙げることができる。また、さらに好ましい態様として、ピリドン骨格の窒素が

炭素数 2 以上のアルキル基等で置換されている点が挙げられる。また、さらに好ましい態様として、ピリドン骨格の 3 位にアミド結合 ( $-C(=O)-NH-$  又は  $-NH-C(=O)-$ ) を有する点が挙げられる。

このような共通の部分構造を有する化合物は、カンナビノイド 2 型受容体親和作用を有しており、それらの化合物の集合であるライブラリーは、抗炎症剤、鎮痛剤、腎炎治療剤等を探索する上で有用である。

また、本化合物のライブラリーは、高活性のカンナビノイド 2 型受容体親和作用を有する化合物（特に、カンナビノイド 2 型受容体拮抗作用を有する化合物）の探索のみならず、他の医薬用途の探索を目的としたスクリーニングにも使用することができる。特に有用な構造活性相關（SAR）を得るためにには、少なとも 10 以上の化合物の集合であることが好ましく、さらには 50 個以上の化合物の集合であることが好ましい。

なお、本発明化合物を少なくとも一つ含むライブラリーであれば、本発明の化合物ライブラリーに含まれる。

15

カンナビノイド 2 型受容体親和性作用とは、カンナビノイド 2 型受容体に結合し、カンナビノイド 2 型受容体作動性またはカンナビノイド 2 型受容体拮抗性作用を示すことを意味する。カンナビノイド 2 型受容体作動性とは、カンナビノイド 2 型受容体に対してアゴニスト作用を示すことを意味する。カンナビノイド 2 型受容体拮抗性とは、カンナビノイド 2 型受容体に対してアンタゴニスト作用を示すことを意味する。

プロドラッグは、生理学的条件下でインピボにおいて薬学的に活性な本発明化合物となる化合物である。適当なプロドラッグ誘導体を選択する方法および製造する方法は、例えば *Design of Prodrugs*, Elsevier, Amsterdam 1985 に記載されている。

本発明に係る化合物のプロドラッグは、脱離基を導入することが可能な A 環上

- の置換基（例えば、アミノ、ヒドロキシ等）に、脱離基を導入して製造することができる。アミノ基のプロドラッグとしては、カルバメート体（例えば、メチルカルバメート、シクロプロビルメチルカルバメート、*tert*-ブチルカルバメート、ベンジルカルバメート等）、アミド体（例えば、ホルムアミド、アセタミド等）、
- 5 N—アルキル体（例えば、N-アリルアミン、N-メトキシメチルアミン等）等が挙げられる。ヒドロキシ基のプロドラッグとしては、エーテル体（メトキシメチルエーテル、メトキシエトキシメチルエーテル等）、エステル体（例えば、アセテート、ビバロエート、ベンゾエート等）等が挙げられる。
- 10 製薬上許容される塩としては、塩基性塩としては、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩等のアルカリ金属塩；カルシウム塩、マグネシウム塩等のアルカリ土類金属塩；アンモニウム塩；トリメチルアミン塩、トリエチルアミン塩、ジシクロヘキシリルアミン塩、エタノールアミン塩、ジエタノールアミン塩、トリエタノールアミン塩、プロカイン塩等の脂肪族アミン塩；N,N-ジベンジルエチレンジアミン等のアラルキルアミン塩；ビリジン塩、ピコリン塩、キノリン塩、イソキノリン塩等のヘテロ環芳香族アミン塩；テトラメチルアンモニウム塩、テトラエチルアモニウム塩、ベンジルトリメチルアンモニウム塩、ベンジルトリエチルアンモニウム塩、ベンジルトリブチルアンモニウム塩、メチルトリオクチルアンモニウム塩、テトラブチルアンモニウム塩等の第4級アンモニウム塩；アルギニン塩、リジン塩等の塩基性アミノ酸塩等が挙げられる。酸性塩としては、例えば、塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩、炭酸塩、炭酸水素塩、過塩素酸塩等の無機酸塩；酢酸塩、プロピオン酸塩、乳酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、酒石酸塩、リンゴ酸塩、クエン酸塩、アスコルビン酸塩等の有機酸塩；メタンスルホン酸塩、イセチオン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩等のスルホン酸塩；アスパラギン酸塩、グルタミン酸塩等の酸性アミノ酸等が挙げられる。

溶媒和物としては、本発明化合物、そのプロドラッグ、又はその製薬上許容さ

れる塩の溶媒和物を意味し、例えば、一溶媒和物、二溶媒和物、一水和物、二水和物等が挙げられる。

本発明化合物は、カンナビノイド2型受容体親和性であり、カンナビノイド2型受容体に結合し、カンナビノイド2型受容体アンタゴニスト作用またはカンナビノイド2型受容体アゴニスト作用を示す。特に、カンナビノイド2型受容体アゴニスト作用を示す。

従って、本発明化合物は、カンナビノイド2型受容体が関与する疾患に対して治療又は予防の目的で使用することができる。例えば、Proc. Natl. Acad. Sci. USA 10 96, 14228-14233.には、カンナビノイド2型受容体アゴニストが抗炎症作用、鎮痛作用を有する旨記載されている。また、Nature, 1998, 349, 277-281には、カンナビノイド2型受容体アゴニストが鎮痛作用を有する旨記載されている。また、Cancer Research 61(2001)5784-5789には、カンナビノイド2型受容体アゴニストが脳腫瘍の退縮作用を有する旨記載されている。また、European Journal of Pharmacology 396 (2000) 85-92には、カンナビノイド2型受容体アンタゴニストが鎮痛作用を有する旨記載されている。さらに、J Pharmacol Exp Ther, 2001, 296, 420-425には、カンナビノイド2型受容体親和性作用（アゴニスト作用及び／又はアンタゴニスト作用）を有する化合物が、抗炎症作用を示す旨記載されている。

すなわち、本発明化合物は、免疫系細胞、炎症系細胞又は末梢神経の活性化を抑制し、末梢細胞系作用（免疫抑制、抗炎症、鎮痛作用）を発現すると考えられ、抗炎症剤、抗アレルギー剤、鎮痛剤、免疫不全治療剤、免疫抑制剤、免疫調節剤、自己免疫疾患治療剤、慢性関節リューマチ治療剤、多発性硬化症治療剤、脳腫瘍治療剤、緑内障治療薬等として用いることができる。

また、カンナビノイド2型受容体作動剤は、ラット Thy-1抗体惹起腎炎に対する抑制効果を有していることが知られており (WO 97/29079)、腎炎治療剤としても有用である。

本発明化合物を治療に用いるには、通常の経口又は非経口投与用の製剤として製剤化する。本発明化合物を含有する医薬組成物は、経口及び非経口投与のための剤形をとることができる。即ち、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤、シロップ剤などの経口投与製剤、あるいは、静脈注射、筋肉注射、皮下注射などの注射用  
5 溶液又は懸濁液、吸入薬、点眼薬、点鼻薬、坐剤、もしくは軟膏剤などの経皮投与用製剤などの非経口投与製剤とすることもできる。

これらの製剤は当業者既知の適当な担体、賦形剤、溶媒、基剤等を用いて製造することができる。例えば、錠剤の場合、活性成分と補助成分と一緒に圧縮又は  
10 成型する。補助成分としては、製剤的に許容される賦形剤、例えば結合剤（例えば、トウモロコシでん粉等）、充填剤（例えば、ラクトース、微結晶性セルロース等）、崩壊剤（例えば、でん粉グリコール酸ナトリウム等）又は滑沢剤（例えば、ステアリン酸マグネシウム等）などが用いられる。錠剤は、適宜、コーティングしてもよい。シロップ剤、液剤、懸濁剤などの液体製剤の場合、例えば、懸  
15 濁化剤（例えば、メチルセルロース等）、乳化剤（例えば、レシチン等）、保存剤などを用いる。注射用製剤の場合、溶液、懸濁液又は油性もしくは水性乳濁液の形態のいずれでもよく、これらは懸濁安定剤又は分散剤などを含有していてもよい。吸入剤として使用する場合は吸入器に適応可能な液剤として、点眼剤として使用する場合も液剤又は懸濁化剤として用いる。

20

本発明化合物の投与量は、投与形態、患者の症状、年令、体重、性別、あるいは併用される薬物（あるとすれば）などにより異なり、最終的には医師の判断に委ねられるが、経口投与の場合、体重1kgあたり、1日0.01～100mg、好ましくは0.01～10mg、より好ましくは0.1～10mg、非経口投与の場合、  
25 体重1kgあたり、1日0.001～100mg、好ましくは0.001～1mg、より好ましくは0.01～1mgを投与する。これを1～4回に分割して投与すればよい。

## 実施例

以下に実施例(説明及び表)を挙げて本発明を詳しく説明するが、これらは単なる例示であり本発明はこれらに限定されるものではない。なお、説明中の実施例番

5 号は表中の化合物番号と同一である。

なお、各略号は以下に示す意味を有する。

Me: メチル、Et: エチル、nPr: n-プロピル、iPr: イソプロピル、

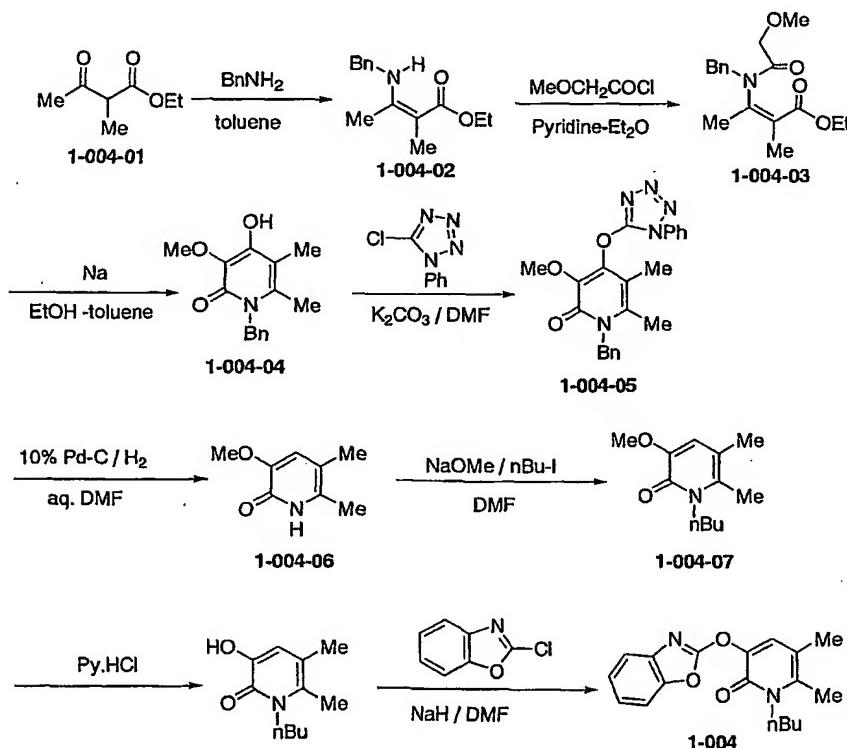
nBu: n-ブチル、iBu: イソブチル、sBu: sec-ブチル、tBu: tert-ブチル

Ph: フェニル、Ac: アセチル、Bn: ベンジル

10 DMF: N,N-ジメチルホルムアミド、THF: テトラヒドロフラン

Ms: メシリル、TBDMS: tert-ブチルジメチルシリル

## &lt;実施例 1-004&gt;



a) エチル 3-ベンジルアミノ-2-メチルクロトナート (1-004-02)の合成

エチル 2-メチルアセトアセタート (1-004-01) (115.34g)、ベンジルアミン (85.73g)、トルエン(1.6L)の溶液を、窒素気流中、145°C油浴中で 8 時間共沸脱水を行った後、ベンジルアミン(12.86g)を追加し更に脱水を行った。6 時間後、そのまま常圧蒸留を行い、約 600ml を留去後、減圧留去しエチル 3-ベンジルアミノ-2-メチルクロトナート(1-004-02)(195.66g)を得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 1.28 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H), 1.80 (s, 3H), 1.93 (s, 3H), 4.13 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 4.43 (d, *J* = 6.3 Hz, 2H), 7.20-7.40 (m, 5H), 9.65 (br s, 1H).

10 b) エチル *N*-ベンジルメトキシアセタミド-2-メチルクロトナート(1-004-03)の合成

エチル 3-ベンジルアミノ-2-メチルクロトナート (1-004-02) (97.83g)をエーテル(2L)に溶。解し、窒素気流中、氷冷攪拌下、ビリジン(35.6ml)を加えいれた後、内温 5~6°Cでメトキシアセチルクロリド(40.2ml)のエーテル溶液を 45 分で滴下した。30 分攪拌後、室温攪拌を行った。2 時間後、反応混合物を冰水(1.5L)中に注入し、エーテルで 2 回抽出後、水洗(1L)1 回後、重曹水溶液で洗浄した。抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去し、エチル 1-ベンジルメトキシアセタミド-2-メチルクロトナート (1-004-03) (111.47g, 91.3%)を油状物で得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 1.21 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H), 1.74 (s, 3H), 1.89 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.97 (d, *J* = 14.7 Hz, 1H), 3.98 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 4.12 (d, *J* = 14.7 Hz, 1H), 4.31 (d, *J* = 14.4 Hz, 1H), 4.95 (d, *J* = 14.4 Hz, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H).

c) 1-ベンジル 5,6-ジメチル-4-ヒドロオキシ-3-メトキシ-2-ピリドン (1-004-04)の合成

窒素気流中、トルエン(1.39l)及びエタノール(2.08ml)の溶液中に金属ナトリウム片 (7.98g)を加え入れ、140°C油浴中で攪拌還流下、エチル (1-ベンジル)-メトキシアセタミド-2-メチルクロトナート (1-004-03) (105.93g)のトルエン(340ml)

溶液を 1 時間 20 分で滴下し、そのまま攪拌還流を行った。2 時間後、反応混合物を氷冷攪拌し、4N 塩酸-ジオキサン(86.8ml)を 10 分で滴下し、その後室温攪拌を行った。2 時間後、析出物をろ取しトルエン洗浄し 73.16g を得た。得られた 73.16g にクロロホルム(500ml)と水(500ml)を加え、65°C 水浴上で加温溶解し振とう分液 5 後、更にクロロホルム(250ml)で抽出し、水洗(250ml)1 回行った後、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去して 54.95g を得た。得られた 54.95g に酢酸エチルエステル(50ml)及びエーテル(50ml)で洗浄し、1-ベンジル 5,6-ジメチル-4-ヒドロオキシ-3-メトキシ 2-ピリドン (1-004-04) (53.95g, 60.0%)を褐色結晶として得た。融点 212°C。

10  $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  2.03 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 3.99 (s, 3H), 5.38 (br s, 2H), 6.41 (br s, 1H), 7.11-7.33 (m, 5H).

d) 1-ベンジル 5,6-ジメチル-3-メトキシ 4-O-(1-フェニル-1H-テトラゾリル)-2-ピリドン (1-004-05)の合成

1-ベンジル 5,6-ジメチル-4-ヒドロオキシ-3-メトキシ 2-ピリドン (1-004-04)(25.93g)及び 5-クロロ-1-フェニル-1H-テトラゾール(21.67g)更に炭酸カリウム (27.64g)に窒素気流中、DMF(300ml)を加え懸濁し室温攪拌を行った。4.5 時間後、反応混合物を氷水(1L)中に注入し酢酸エチル(500ml)で 3 回抽出後、水洗(500ml)2 回行った後、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去した。得られた残渣(42.4g)をアセトン(300ml)に加温溶解し減圧濃縮後、エーテル(300ml)を加え析出 15 した結晶を濾取し、1-ベンジル 5,6-ジメチル-3-メトキシ 4-O-(1-フェニル-1H-テトラゾリル)-2-ピリドン (1-004-05) (29.87g, 74.0%, 融点 178°C)を得た。又濾液をシリカゲルカラムクロマト(150g,  $\text{CHCl}_3$ )精製を行い、更に 1-004-05 (4.3g, 10.7%)を得た。

20  $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  2.07 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.41 (br s, 2H), 7.15-7.84 (m, 10H).

e) 5,6-ジメチル-3-メトキシ 2-ピリドン (1-004-06) の合成

1-ベンジル 5,6-ジメチル-3-メトキシ 4-O-(1-フェニル-1H-テトラゾリル)-2-ピリ

ドン (1-004-05) (27.15g) の DMF(272ml) 溶液に 10% パラジウム炭素(5.43g) の水 (27ml) 懸濁液を加え、5kg / cm<sup>2</sup> 加圧下、室温で中圧還元を行った。途中で 10% パラジウム炭素(2.72g) を追加した。48 時間後、触媒をセライト上で濾去しメタノール洗浄し減圧留去した。得られた残渣に水(160ml)を加え、85°C 水浴上で加熱し不溶物を濾去し熱水で洗浄し(不溶物、8.77g) 減圧留去し、得られた残渣 (11.55g) にアセトン(110ml)を加え室温攪拌後、無色粉末を濾取し、1-004-06 (8.23g, 79.8%, 融点 215-9°C)を得た。又濾液から同様の処理を行い、更に 1-004-06 (0.31g, 3.0%)を得た。

1H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 2.07 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.41 (br s, 2H), 7.15-7.84 (m, 10H).

f) 1-ブチル 5,6-ジメチル-3-メトキシ 2-ピリドン(1-004-07) の合成

5,6-ジメチル-3-メトキシ 2-ピリドン (1-004-06) (306mg) 及び水酸化カリウム (157mg) に n-ブタノール(13ml) を加え懸濁し窒素気流中、1-ヨードブタン (0.44ml) を加え、85°C 油浴中で加熱攪拌を行った。24 時間後、反応混合物を減圧留去し、残渣を酢酸エチルと水に溶解し酢酸エチルで 2 回抽出後、水洗 1 回行い、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去した。得られた残渣 (330mg) をシリカゲルカラムクロマト(ローバーカラム B, トルエン-アセトン(3:1))を行い、1-ブチル 5,6-ジメチル-3-メトキシ 2-ピリドン (1-004-07) (124mg, 29.6%)を得た。

1H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.48 (m, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 2.09 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.08 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 6.44 (s, 1H).

g) 1-ブチル 5,6-ジメチル-3-ハイドロキシ 2-ピリドン (1-004-08) の合成

1-ブチル 5,6-ジメチル-3-メトキシ 2-ピリドン(1-004-07)(124mg) にビリジニウムクロリド(293mg)を加え、窒素気流中、200°C 油浴中で加熱攪拌を行った。30 分後、反応混合物にエーテル及び水を加え溶解しエーテルで 2 回抽出し水洗 1 回行い、硫酸マグネシウムで乾燥後減圧留去した。1-ブチル 5,6-ジメチル-3-ハイドロキシ 2-ピリドン (1-004-08) (94mg, 81%, 融点 112-116°C)を得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.98 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.50 (m, 2H), 1.61-1.72 (m, 2H), 2.08 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 4.10 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 6.66 (br s, 2H).

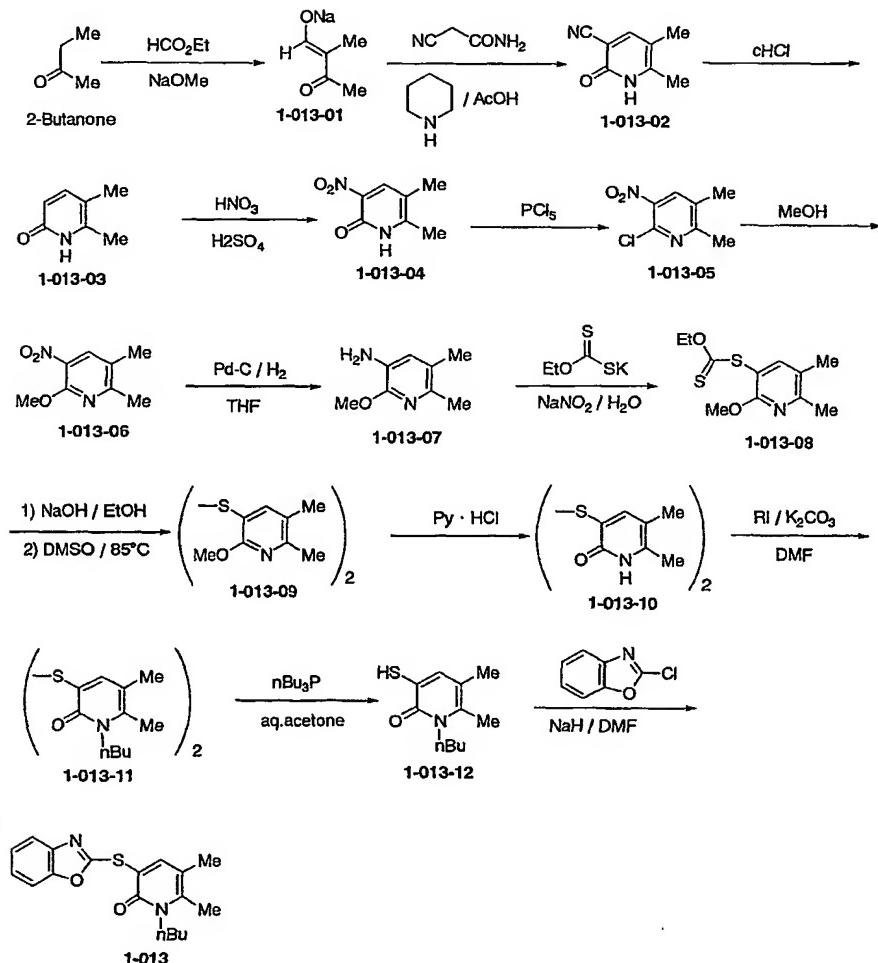
h) 3-(ベンゾオキサゾール 2-イルオキシ)-1-ブチル-5,6-ジメチル-1*H*-ピリジン-2-

## 5 オン (1-004) の合成

1-015 と同様に行った (66.7%, 融点 106-8°C)。

実施例 1-001～実施例 1-003 と実施例 1-005 は、実施例 1-004 と同様に合成した。

## 10 <実施例 1-013>



a) 2-メチル-3-オキソ-ブタナール・ナトリウム塩 (1-013-01)の合成

28% ナトリウムメトキシド-メタノール溶液(138ml)に窒素気流中、エーテル(920ml)を加え希釈し、氷冷攪拌下、2-ブタノン(51.2g)とエチルホルムエート(57.2g)の混合物を内温 4~6°Cにて 45 分で滴下し 30 分攪拌後、一晩室温攪拌を行った。翌日、析出した無色粉末をろ取し、2-メチル-3-オキソ-ブタナール・ナトリウム塩 5 (1-013-01) (60.66g, 70%)を得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 1.62 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 8.99 (s, 1H).

b) 3-シアノ-5,6-ジメチル-2-ピリドン (1-013-02)の合成

2-メチル-3-オキソ-ブタナール・ナトリウム塩 (1-013-01) (34.73g)に水(546ml)を加え、2-シアノアセタミド(23.91g)を加え入れ、続いて 1.76 モル ビペ 10 リジニウムアセタート(119.4ml)を加え、127°C油浴中で攪拌還流を行った。21 時間後、反応液に酢酸(42.7ml)を内温 65°Cの時に少しづつ加え入れ(15 分)、そのまま攪拌を行い、内温 24°Cになってから析出した結晶をろ取し水洗し、3-シアノ-5,6-ジメチル-2-ピリドン (1-013-02) (27.76g, 65.9%, 融点 258-263°C)を得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, DMSO): δ 1.98 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 7.95 (s, 1H), 12.45 (br 15 s, 1H).

c) 5,6-ジメチル-2-ピリドン (1-013-03)の合成

3-シアノ-5,6-ジメチル-2-ピリドン (1-013-02) (12.0g)に水(293ml)を加え懸濁し、濃塩酸(293ml)を加え、135°C油浴中で攪拌還流を行った。3 日後、反応液を冷却し減圧留去した。残渣(24.75g)にクロロホルム(300ml)とメタノール(15ml)を 20 加え、65°C水浴上で加温し不溶物をろ去した。更に不溶物をクロロホルム(200ml)とメタノール(10ml)で同様に処理した。溶液部を合併し減圧留去した。得られた残渣(13.26g)にメタノール(150ml)を加え、炭酸カリウム(10g)を加え、30 分室温攪拌後、不溶物をろ去し減圧留去した。得られた残渣(14.7g)にクロロホルム(200ml)を加え、再び不溶物をろ去し減圧留去して 5,6-ジメチル-2-ピリドン (1- 25 013-03) (9.41g, 94.3%, 融点 202-207°C)を得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 2.05 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 6.38 (d, *J* = 9.0 Hz, 1H), 7.26 (d, *J* = 9.0 Hz, 1H), 13.17 (br s, 1H).

## d) 5,6-ジメチル-3-ニトロ-2-ピリドン (1-013-04)の合成

5,6-ジメチル-2-ピリドン (1-013-03) (3.695g)に氷冷下、濃硫酸(38ml)を加え溶解し氷冷攪拌下、70% 硝酸(3.53ml)を内温 3~5°Cで 50 分で滴下しそのまま攪拌した。2 時間後、反応液を氷中に少しづつ加え入れ、析出した結晶をろ取し水洗し

5 5,6-ジメチル-3-ニトロ-2-ピリドン (1-013-04) (3.102g, 61.5%, 融点 251-257(dec))を得た。又、水層をクロロホルム 5 回抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し析出した結晶をろ取し、更に 271mg(5.4%)を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, DMSO): 2.06 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 8.35 (s, 1H), 12.79 (br s, 1H).

## 10 e) 2-クロロ-5,6-ジメチル-3-ニトロ-ピリジン (1-013-05)の合成

5,6-ジメチル-3-ニトロ-2-ピリドン (1-013-04) (841mg)及び五塩化磷(1.25g)を窒素気流中、140°C油浴中で加熱攪拌を行った。35 分後、反応混合物を氷冷し、氷水中に注入しクロロホルムで 2 回抽出し、水洗 1 回後、飽和重曹水で洗浄し、脱色炭を加え、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去し結晶性残渣の 2-クロロ-5,6-

15 ジメチル-3-ニトロ-ピリジン (1-013-05) (842mg, 90.2%)を得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 2.38 (s, 3H), 2.58 (s, 3H), 8.01 (s, 1H).

## f) 5,6-ジメチル-2-メトキシ-3-ニトロ-ピリジン (1-013-06)の合成

28% ナトリウムメトキシド(1.11ml)とメタノール(5.5m)中に窒素気流中、室温攪拌下、2-クロロ-5,6-ジメチル-3-ニトロ-ピリジン (1-013-05) (837mg)のメタノール(6.6ml)溶液を 5 分で滴下し 50°C油浴中で 7 時間加熱攪拌を行った。反応液にエーテルを加え氷中に注入し、エーテル 2 回抽出後、水洗 1 回行い硫酸マグネシウムで乾燥し減圧留去しオレンジ色結晶の 5,6-ジメチル-2-メトキシ-3-ニトロ-ピリジン (1-013-06) (675mg, 82.6%, 融点 71-73°C)を得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 2.28 (s, 3H), 2.48 (s, 3H), 4.08 (s, 3H), 8.07 (s, 1H).

## g) 3-アミノ-5,6-ジメチル-2-メトキシピリジン (1-013-07)の合成

5,6-ジメチル-2-メトキシ-3-ニトロ-ピリジン (1-013-06) (2.56g)をテトラヒド

ロフラン(41ml)に溶解し 5% パラジウム炭素(450mg)のメタノール(41ml)懸濁液を加え、接触還元を行った。3 時間後、触媒をろ去し減圧留去し褐色結晶の 3-アミノ-5,6-ジメチル-2-メトキシピリジン (1-013-07) (2.096g, 97.9%, 融点 56-58°C)を得た。

5       $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  2.12 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.48-3.49 (br s, 2H), 3.95 (s, 3H), 6.70 (s, 1H).

h) 5,6-ジメチル-3-[[エトキシ(チオカルボニル)]チオ]-2-メトキシピリジン (1-013-08) の合成

3-アミノ-5,6-ジメチル-2-メトキシピリジン (1-013-07) (1.787g)を水(3ml)と濃塩酸(3ml)に溶解後、氷-アセトン冷浴に浸し、冷却攪拌下、亜硝酸ソーダ(4.81g)の水(27.1ml)溶液を内温-4~ -5°Cで 45 分で滴下後、そのまま 20 分攪拌した。一方、エチルキサントゲン酸カリウム(12.64g)を水(17.3ml)に溶解し、40°C油浴中で加温攪拌下、先に調製したジアゾニウム塩の冷却溶液を 35 分で加え入れ、その後 40 分加熱攪拌を行った。反応混合物を氷冷後、クロロホルム 3 回抽出し飽和重曹水 1 回、次いで飽和食塩水 1 回、洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し減圧留去した。赤色オイルの残渣(12.49g)をシリカゲルカラムクロマト(300g, トルエン-ヘキサン(2:3))を行い、5,6-ジメチル-3-[[エトキシ(チオカルボニル)]チオ]-2-メトキシピリジン (1-013-08) (6.281g, 36%)を赤色液体として得た。尚、ここで得られた化合物は回転障害と思われる 2 種類を含んでいた。

20       $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  1.45 (t,  $J = 7.2 \text{ Hz}$ , 3H), 2.18 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.98 (s, 3H), 4.70 (q,  $J = 7.2 \text{ Hz}$ , 2H), 7.47 (s, 1H).

$^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  1.33 (t,  $J = 7.2 \text{ Hz}$ , 3H), 2.21 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 3.94 (s, 3H), 4.60 (q,  $J = 7.2 \text{ Hz}$ , 2H), 7.43 (s, 1H).

i) (5,6-ジメチル-2-メトキシピリジン-3-イル)ジスルフイド (1-013-09)の合成

25      5,6-ジメチル-3-[[エトキシ(チオカルボニル)]チオ]-2-メトキシピリジン (1-013-08) (6.275g)をエタノール(200ml)に溶解し窒素気流中、室温攪拌下、1N 水酸化ナトリウム(67ml)を一時に加え入れ、一晩攪拌を行った。15 時間後、析出物をろ

取し水洗し(543mg)を得た。又、ろ液に5N 塩酸水溶液を加え pH 3 とし減圧留去し残渣(7.6g)に塩化メチレン(100ml)を加え室温攪拌後、不溶物をろ去し再び減圧留去し(2.00g)を得た。

続いて、上で得られた 2.00g と 543mg を合併しジメチルスルフォキサイド  
 5 (20ml)と懸濁し、窒素気流中、85°C油浴中で加熱攪拌を行った。7 時間後、反応混合物に室温攪拌化、水(100ml)を加え入れ、30 分間氷冷攪拌後、析出した黄色粉末として(5,6-ジメチル-2-メトキシビリジン-3-イル)ジスルファイド (1-013-09) (2.23g, 54.4%)を得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 2.16 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 7.53 (s,  
 10 1H).

J) (5,6-ジメチル-2-ピリドン-3-イル)ジスルファイド (1-013-10) の合成

(5,6-ジメチル-2-メトキシビリジン-3-イル)ジスルファイド (1-013-09) (2.225g)に  
 ピリジニウムクロリド(7.69g)を加え、窒素気流中、160°C油浴中で加熱攪拌した。  
 40 分後、反応混合物を冷却後、水(100ml)を加え室温攪拌しろ取し水洗し褐色粉  
 15 末の(5,6-ジメチル-2-ピリドン-3-イル)ジスルファイド (1-013-10) (1.736g, 85.1%)  
 を得た。又、水層をクロロホルムで 2 回抽出し水洗 2 回行い硫酸マグネシウムで  
 乾燥し減圧留去して得られた残渣(81mg)をエタノール処理し、更に黄色粉末の目  
 的物(41mg, 2.0%)を得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 1.95 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 7.42 (s, 1H), 11.89 (br  
 20 s, 1H).

k)(1-ブチル 5,6-ジメチル-2-ピリドン-3-イル)ジスルファイド (1-013-11)の合成

(5,6-ジメチル-2-ピリドン-3-イル)ジスルファイド (1-013-10) (31mg)を  
 DMF(1ml)と懸濁し、1-ヨードブタン(78mg)続いて炭酸カリウム(42mg)を加え窒  
 気流中、3 日間室温攪拌を行った。反応混合物に酢酸エチルを加え水中に注入し、  
 25 酢酸エチル 2 回抽出後、水洗 1 回行い硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去し  
 (39mg, 92.9%)を得た。尚、ここで得た化合物はNMRより 20%の 1-ブチル体  
 (1-013-11)を含む。

## 1) 1-ブチル 5,6-ジメチル-3-メルカプト-2-ピリドン (1-013-12)の合成

(1-ブチル 5,6-ジメチル-2-ピリドン-3-イル)ジスルファイド (1-013-11) (123mg)をアセトン(8ml)に溶解し、室温攪拌下、トリ-n-ブチルホスフィン(0.16ml)を加え水(4ml)を少しづつ加えた。そのまま2時間攪拌後、一晩室温放置した。反応液を塩化メチレンで希釈し水を加え、塩化メチレンで2回抽出し水洗1回行い硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去した。得られた残渣(277mg)を分取薄層クロマトグラフィー(トルエン・アセトン(39:1))を行い、結晶性の1-ブチル 5,6-ジメチル-3-メルカプト-2-ピリドン (1-013-12) (11mg, 8.9%)を得た。

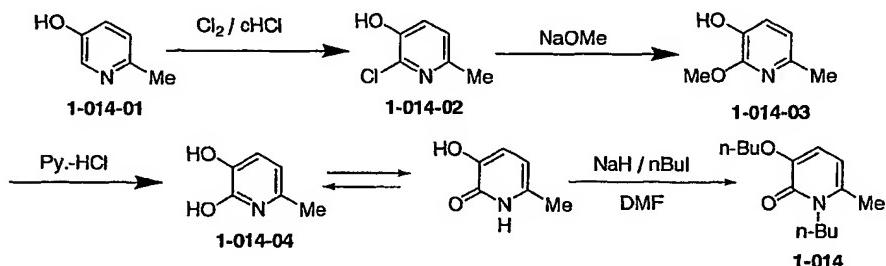
<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.93 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.32-1.45 (m, 2H), 1.62-1.72 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 4.20 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 7.68 (s, 1H).

m) N-1-ブチル 5,6-ジメチル-3-(ベンズオキサゾール 2-イル)チオ-2-ピリドン (1-013)

先の実施例 1-015 と同様に行い、1-ブチル 5,6-ジメチル-3-メルカプト-2-ピリドン (11mg)から、結晶性の 1-013 (4.5mg, 26.5%)を得た。

また、実施例 1-013 と同様な手法により、実施例 1-012 も合成した。

## &lt;実施例 1-014&gt;



20 a) 2-クロロ-3-ハイドロキシ 6-メチルピリジン (1-014-02) の合成

5-ハイドロキシ 2-メチルピリジン (1-014-01) (27.01g)に濃塩酸 (200ml)を加えて溶解し、68-74°Cにて塩素ガスを7時間通じた。反応液を一夜放置後、窒素ガスを通じ揮発性物を除去し、ついで減圧濃縮して結晶性残渣を得た。メタノールに

溶かし活性炭処理後、再結晶し目的とする 2-クロロ-3-ハイドロキシ 6-メチルピリジン (1-014-02) (23.96g, 67.3%)を得た。

b) 2-メトキシ-3-ハイドロキシ 6-メチルピリジン (1-014-03)の合成

金属製封管に 2-クロロ-3-ハイドロキシ 6-メチルピリジン (1-014-02) (22.91g)

5 および 28%ナトリウムメトキシド-メタノール溶液 (120ml)を加え 150°Cにて 3 日間反応した。反応液に氷水 (100ml)を加え酢酸にて中和して反応液をすべて乾固した。この残渣をクロロホルムにてシリカゲルクロマトを行い目的とする 2-メトキシ-3-ハイドロキシ 6-メチルピリジン (1-014-03) (10.44 g, 48.1%)を得た。また原料をふくむフラクションは再度、封管中で反応を行った。

10 <sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 2.35 (s, 3H), 3.97 (s, 3H), 6.60 (d, J = 7.8Hz, 1H), 6.98 (d, J = 7.8Hz, 1H).

c) 2,3-ジハイドロキシ 6-メチルピリジン (1-014-04) の合成

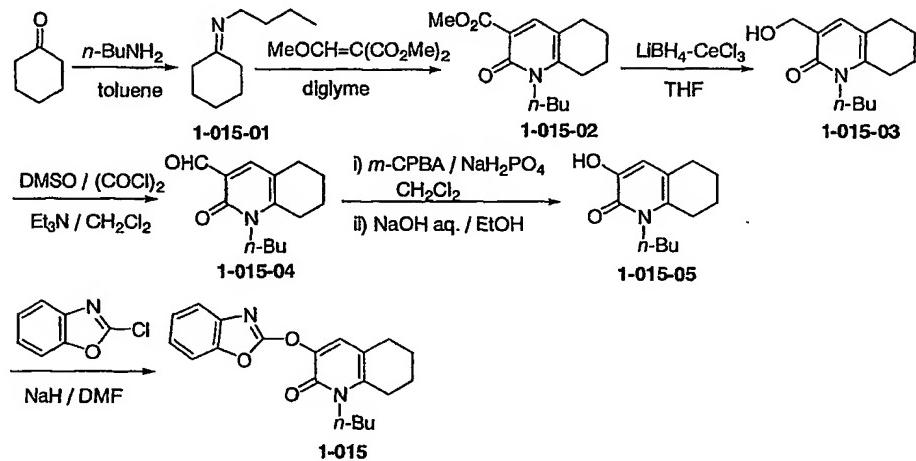
先の実験で得られた 2-メトキシ 3-ハイドロキシ 6-メチルピリジン (1-014-03) (10.43g) にピリジン塩酸塩 43.3g を加え、窒素気流下 160°Cで 1 時間さらに 170°C 15 で 20 分加熱反応した。反応液に H<sub>2</sub>O (50ml)を加え 5%メタノール/酢酸エチルおよび酢酸エチルにて抽出を繰り返したのち、可溶物を併せ濃縮乾固することにより灰白色の残渣を得た。この 2,3-ジハイドロキシ 6-メチルピリジン (1-014-04) は精製することなくつぎの反応に用いた。

d) 1-ブチル 3-ブチル-6-メチル-2-ピリドン (1-014-05) の合成

20 粗製の 2,3-ジハイドロキシ 6-メチルピリジン (1-014-04) (16.04g)を乾燥 DMF (70 ml) に溶かし固体で 60%水素化ナトリウム (10.25g)を少量ずつ加え窒素下室温にて 30 分攪拌反応させた。つぎに 1-ヨードブタン(29.1 ml)-DMF (30ml)よりなる溶液を 20 分で滴下、室温にて 3 時間反応させた。反応後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え酢酸エチル 150ml にて 3 回抽出した。さらに水層をクロロホルムにて抽出を重ね、有機層を併せて活性炭処理し濃縮した。得られた残渣は n-ヘキサン-酢酸エチルを用いたシリカゲルクロマトを行い油状の 1-ブチル 3-O-ブチル-6-メチル-2-ピリドン (1-014) (8.915g) を得た。(収率 50.1% 2 工程)

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.96 (t, *J* = 7.5 Hz, 6H), 1.43 (m, 4H), 1.67 (m, 2H), 1.82 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 3.88 (t, *J* = 6.6 Hz, 2H), 4.01 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 5.87 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 6.52 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H).

## 5 <実施例 1-015>



### a) プチル-シクロヘキシリデン-アミン (1-015-01)の合成

シクロヘキサン (10.36 ml, 0.1 mol)に、1-ブチルアミン (9.88 ml, 0.1 mol)とトルエン (15 ml)を加え、モレキュラーシーブ 4A を入れたディーンスターク還流管を用いて脱水条件下、24 時間加熱還流した。反応液を室温まで冷却後減圧濃縮し、残渣を減圧蒸留(64°C, 2 mmHg)して、ブチル-シクロヘキシリデン-アミン (1-015-01) (12.8 g, 84%)を無色油状物質として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.93 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H), 1.35 (sextet, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.58 (quint, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.70 (m, 4H), 1.71-1.77 (m, 2H), 2.30 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.34 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 3.30 (t, *J* = 7.5 Hz, 2H).

### b) 1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸メチルエステル (1-015-02)の合成

ブチル-シクロヘキシリデン-アミン (1-015-01) (12.8 g, 83.6 mmol)をジグライム (75 ml)に溶解し 120°C に加熱した。この溶液にメトキシメチレンマロン酸ジメチル (14 g, 80.4 mmol)のジグライム溶液 (75 ml)を 1 時間かけて滴下しさらに

3 時間 120°C で反応させた。反応液を冷却後、ジグライムを減圧留去し、得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸メチルエス

テル (1-015-02) (15 g, 71%)を黄色油状物質として得た。

5      <sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.63-1.78 (m, 4H), 1.87 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 2.57 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.73 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.90 (s, 3H), 4.02 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 7.92 (s, 1H).

c) 1-ブチル-3-ヒドロキシメチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン (1-015-03)の合成

10     1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸メチルエステル (1-015-02) (130 mg, 0.5 mmol)を THF (12 ml)に溶解し、CeCl<sub>3</sub>·7H<sub>2</sub>O (372.6 mg, 1 mmol)と水素化ホウ素リチウム (21.8 mg, 1 mmol)を加え、室温で20 分攪拌した。反応液に希塩酸 (1N, 20 ml)を加え酢酸エチル (40 ml)で抽出後、飽和食塩水 (30 ml)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。この

15     残渣をもう一度上記と同じ条件で反応させ、同様の反応後処理を行った。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、1-ブチル-3-ヒドロキシメチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン (1-015-03)

(80 mg, 68%)を無色油状物質として得た。

18     <sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.98 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.65 (quint, J = 7.5 Hz, 2H), 1.71 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 1.85 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 2.52 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.68 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.00 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 4.53 (s, 2H), 7.02 (s, 1H).

d) 1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-カルボアルデヒド (1-015-04)の合成

25     DMSO (0.54 ml, 7.64 mmol)を塩化メチレン (27 ml)に溶解し-78°C に冷却した。この溶液にオキザリルクロリド (0.4 ml, 4.58 mmol)と 1-ブチル-3-ヒドロキシメチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン (1-015-03) (0.9 g, 3.82 mmol)の

塩化メチレン溶液 (20 ml)をこの順番に滴下し、さらにトリエチルアミン (1.33 ml, 9.55 mmol)を加え、-78°Cで5分攪拌した後、徐々に室温へ昇温した。室温でさらに20分攪拌した後、反応液に希塩酸 (1N, 50 ml)を加え酢酸エチル (200 ml)で抽出後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (50 ml)、飽和食塩水 (50 ml)で洗浄、  
 5 無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-カルボアルデヒド (1-015-04) (0.5 g, 56%)を淡黄色泡状物質として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.46 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.68 (quint, J = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 2.59 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.76 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.05 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 7.76 (s, 1H), 10.34 (s, 1H).

e) 1-ブチル-3-ヒドロキシ-5,6,7,8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン (1-015-05) の合成

15 1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-カルボアルデヒド (1-015-04) (160 mg, 0.69 mmol)を塩化メチレン (10 ml)に溶解し、NaH<sub>2</sub>PO<sub>4</sub>·H<sub>2</sub>O (190 mg, 1.38 mmol)とメタクロロ過安息香酸 (237 mg, 1.38 mmol)を加え、室温で30分攪拌した。反応液に5%チオ硫酸ナトリウム水溶液 (20 ml)を加え酢酸エチル (50 ml)で抽出後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (20 ml)、飽和食塩水 (20 ml)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。残渣をエタノール (5 ml)に溶解し、水酸化ナトリウム水溶液 (2M, 0.35 ml, 0.7 mmol)を加え、室温で30分攪拌した。反応液に希塩酸 (0.2N, 7 ml)を加え酢酸エチル (25 ml)で抽出後、飽和食塩水 (10 ml)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、1-ブチル-3-ヒドロキシ-5,6,7,8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン (1-015-05) (82 mg, 54%)を淡褐色結晶として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.42 (sextet, J = 7.5 Hz,

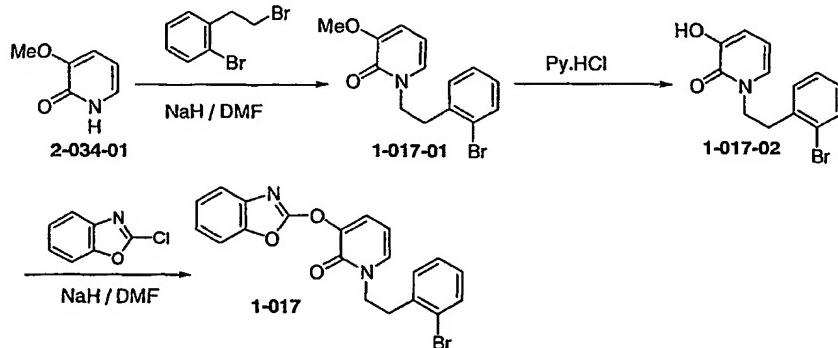
2H), 1.60-1.74 (m, 4H), 1.83 (quint,  $J = 6.0$  Hz, 2H), 2.50 (t,  $J = 6.0$  Hz, 2H), 2.62 (t,  $J = 6.0$  Hz, 2H), 4.02 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 6.57 (s, 1H).

f) 3-(ベンゾオキサゾール 2-イルオキシ)1-ブチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン (1-015)の合成

5 1-ブチル-3-ヒドロキシ-5,6,7,8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン (1-015-05) (10 mg, 0.045 mmol)を DMF (1 ml)に溶解し、水素化ナトリウム (60% oil suspension, 2.7 mg, 0.068 mmol)を加え室温で 5 分激しく攪拌した。この溶液に 2-クロロベンゾオキサゾール (7.7  $\mu$ l, 0.068 mmol)を加え室温で 20 分攪拌、反応液に希塩酸 (1N, 3 ml)を加え酢酸エチル (8 ml)で抽出後、飽和食塩水 (4 ml)で 10 洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、3-(ベンゾオキサゾール 2-イルオキシ)1-ブチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン (1-015) (12 mg, 79%)を淡黄色粉末として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>):  $\delta$  0.94 (t,  $J = 7.5$  Hz, 3H), 1.40 (sextet,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 1.66 (quint,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 1.74 (quint,  $J = 6.0$  Hz, 2H), 1.87 (quint,  $J = 6.0$  Hz, 2H), 2.58 (t,  $J = 6.0$  Hz, 2H), 2.69 (t,  $J = 6.0$  Hz, 2H), 4.02 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 7.16-7.26 (m, 2H), 7.24 (s, 1H), 7.40 (dd,  $J = 6.9$  Hz, 2.4 Hz, 1H), 7.48 (dd,  $J = 6.9$  Hz, 2.4 Hz, 1H).

20 <実施例 1-017>



a) 1-(2-ブロモフェニル)-3-メトキシ-2-ピリドン (1-017-01)の合成

2-034-02 と同様にして合成した (44%)。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 3.22 (t, *J* = 7.3 Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 4.21 (t, *J* = 7.6 Hz, 2H), 5.96 (t, *J* = 7.3 Hz, 1H), 6.60 (m, 2H), 7.07-7.22 (m, 3H), 7.55 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H).

5 b) 1-(2-プロモフェネチル)-3-ヒドロキシ-2-ピリドン (1-017-02)の合成

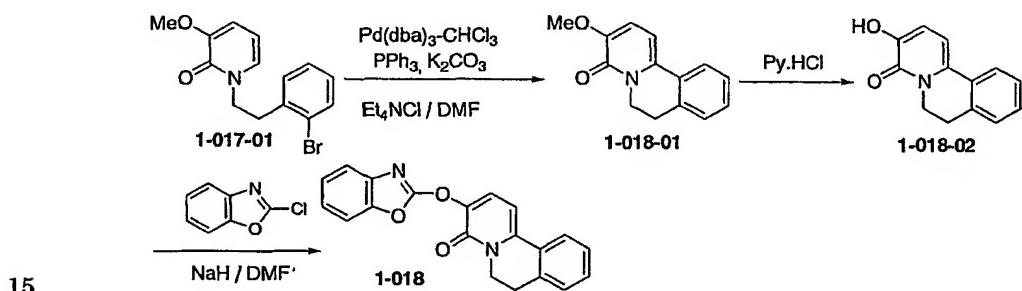
1-004-08 と同様にして合成した (100%)。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 3.23 (t, *J* = 7.3 Hz, 2H), 4.23 (t, *J* = 7.3 Hz, 2H), 6.02 (t, *J* = 7.0 Hz, 1H), 6.57 (dd, *J* = 7.0, 1.2 Hz, 1H), 6.78 (dd, *J* = 7.3, 1.8 Hz, 1H), 7.08-7.14 (m, 2H), 7.18-7.23 (m, 1H), 7.56 (dd, *J* = 7.0, 1.2 Hz, 1H).

10 c) 3-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ)-1-(2-プロモフェニル)-3-ヒドロキシ-2-ピリドン(1-017)の合成

1-015 と同様にして合成した (70%)。

<寒施例 1-018>



a) 3-メトキシ-6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-4-オン (1-018-01)の合成

1-(2-ブロモフェネチル)-3-メトキシ 2-ピリドン (1-017-01) (100 mg) の DMF (4.0 ml) 溶液に、室温で Pd(dba)<sub>3</sub> · CHCl<sub>3</sub> (30 mg), Et<sub>4</sub>NCl (54 mg)，及び炭酸カリウム (67 mg) を加えた。120 °Cで 3 時間攪拌した後、溶媒を留去し、残渣に

20 飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加え有機相を分離した。水相を酢酸エチルで3回抽出した後、合わせた有機相を水、飽和食塩水で順次洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去し、得られた粗生成物を分取薄層クロマトグラフィー(トルエン/アセトン=1/1)で精製することにより3-メト

キシ 6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-4-オン (1-017-02) (50.6 mg, 69%) を油状物質として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 2.97 (t, J = 6.4 Hz, 2H), 3.88 (s, 3H), 4.34 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 6.64 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 6.74 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.23-7.34 (m, 3H), 5 7.64-7.67 (m, 1H).

b) 3-ヒドロキシ-6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-4-オン (1-018-02)の合成

1-004-08 と同様にして合成した (98%)。

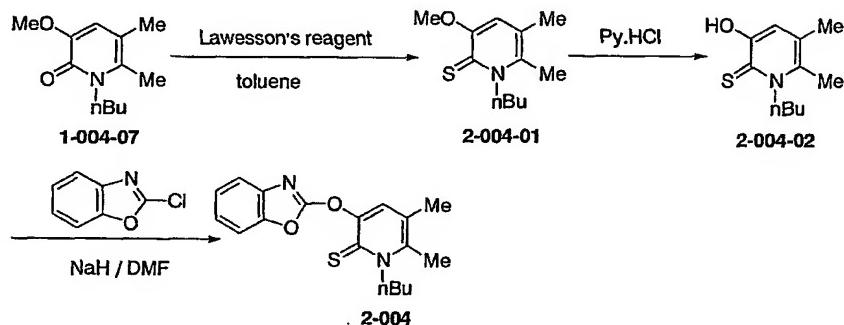
<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 3.00 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 4.35 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 10 6.71 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.24-7.34 (m, 3H), 7.64-7.68 (m, 1H).

d) 3-(ベンゾオキサゾール 2-イルオキシ)-6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-4-オン (1-018)の合成

1-004 と同様にして合成した (47%)。

15

<実施例 2-004>



a) 1-ブチル 5, 6-ジメチル-3-メトキシ 2-チオ-ピリドン (2-004-01)の合成

1-ブチル 5, 6-ジメチル-3-メトキシ 2-ピリドン (1-004-07) (222mg)及びローソン試薬(502mg)にトルエン(8ml)を加え懸濁し、窒素気流中、攪拌還流を行った。7時間後、反応混合物にメタノール(25ml)を加え 室温攪拌し、1時間後、減圧留去した。残渣(0.80g)をローバーカラムBでシリカゲルカラムクロマト(トルエン・ア

セトン(4:1))を行い、1-ブチル 5,6-ジメチル-3-メトキシ 2-チオ-ピリドン (2-004-01) (177mg, 74.1%, 融点 111-112°C)。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 1.00 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.43-1.55 (m, 2H), 1.70-1.95 (br s, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 3.89 (s, 3H), 4.90 (br s, 2H), 6.54 (s, 1H).

b) N-1-ブチル 5,6-ジメチル-3-ヒドロキシ-2-チオ-ピリドン (2-004-02)

1-013-10 と同様に行うことにより、2-004-01 (170mg)から 1-ブチル 5,6-ジメチル-3-ヒドロキシ-2-チオ-ピリドン (2-004-02) (118mg, 74.2%, 融点 81-88°C)を得た。

10 <sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 1.02 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.45-1.57 (m, 2H), 1.70-1.90 (m, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 4.72 (br s, 2H), 6.87 (s, 1H), 8.44 (br s, 1H).

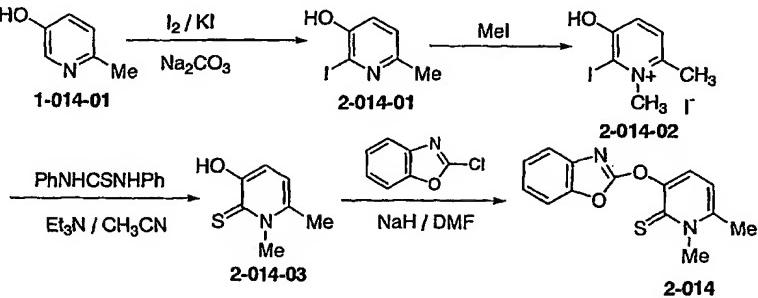
c) 1-ブチル 5,6-ジメチル-3-O-(ベンズオキサゾール 2-イル)-2-チオ-ピリドン (2-004) の合成

15 実施例 1-004 と同様に行うことにより、2-004-02 (118mg)から 1-ブチル 5,6-ジメチル-3-O-(ベンズオキサゾール 2-イル)-2-チオ-ピリドン (2-004) (84mg, 45.9%, 融点 185-187°C)を得た。

実施例 2-001～実施例 2-013 は、実施例 2-004 と同様に合成した。

20 <実施例 2-014>

a) 2-ヨード-3-ハイドロキシ 6-メチルピリジン (2-014-01) の合成



5-ハイドロキシ 2-メチルピリジン(1-014-01) (36.11g)に炭酸ソーダ (68.0g) お

および水 (810ml)を加えて室温にて攪拌溶解した後、ヨウ素 (117g)、ヨウ化カリウム (117g)および水 (810ml)よりなる溶液を 35 分要して滴下した。反応液に析出してくる橙黄色の結晶をろ過、減圧乾燥して 2-ヨード 3-ハイドロキシ 6-メチルビリジン (2-014-01) (34.1g, 43.9%, 融点 187-190°C)を得た。

5       $^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3+\text{CD}_3\text{OD}$ ):  $\delta$  2.45 (s, 3H), 6.45 (d,  $J = 6.9$  Hz, 1H),  
7.02 (dd,  $J = 6.6, 1.5$  Hz, 1H)

b) 3-ハイドロキシ 2-ヨード 1,6-ジメチル-ピリジニウム ヨージド (2-014-02) の合成

ガラス製の封管に 2-ヨード 3-ハイドロキシ 6-メチルビリジン 835mg およびヨードメタン 3ml を入れ、130°Cで 4 時間さらに 180°Cで 1 時間反応した。反応液は濃縮乾固し 1.42g の 3-ハイドロキシ 2-ヨード 1,6-ジメチル-ピリジニウム ヨージド (2-014-02)を得た。

c) 1, 6-ジメチル-3-ハイドロキシ 2-チオピリドン (2-014-03) の合成

3-ハイドロキシ 2-ヨード 1,6-ジメチル-ピリジニウム ヨージド (2-014-02)

15     (852mg) にトリエチルアミン 457mg およびアセトニトリル 10ml よりなる溶液に、1, 3-ジフェニルチオ尿素 517mg を加え 2 時間還流した。反応後、濃縮しシリカゲルクロマト(*n*-ヘキサン-酢酸エチルにて溶出)を行い 279mg の 1, 6-ジメチル-3-ハイドロキシ 2-チオピリドン (2-014-03)を得た。

16      $^1\text{H NMR}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  2.47 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 6.53 (d,  $J = 8.1$  Hz, 1H),  
6.95 (d,  $J = 8.1$  Hz, 1H), 8.35 (br s, 1H).

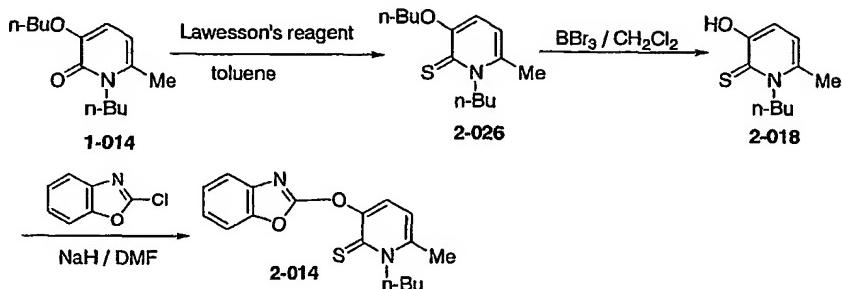
d) 3-(ベンゾオキサゾール 2-イルオキシ)-1,6-ジメチル-1*H*-ピリジン-2-チオン (2-014) の合成

1,6-ジメチル-3-ハイドロキシ 2-チオピリドン (2-014-03) (157 mg)を DMF (3ml)に溶かし 60%水素化ナトリウム 52mg を加えて室温にて 7 分反応させた。

20     この反応液に 2-クロロベンゾオキサゾール (184 mg)を DMF (0.5 ml) にて洗い込み、室温にて 2 時間反応させた。反応後、飽和塩化アンモニア水溶液および酢酸エチルにて繰り返し抽出し、シリガゲルクロマトにて精製しイソプロパノール/ク

クロロホルムより再結晶を行うことにより、3-(ベンゾオキサゾール 2-イルオキシ)-1,6-ジメチル-1*H*-ピリジン-2-チオン (2-014) (182 mg, 66.8%, 融点 245-247°C)を得た。

### 5 <実施例 2-015、2-018、2-026>



#### a) 1-ブチル 3-ブチル-6-メチル-2-チオピリドン(2-026)の合成

1-ブチル 3-ブチル-2-ピリドン (1-014) (8.91 g)に乾燥トルエン (200 ml)に溶かしローソン試薬 (19.41 g)を加え窒素気流下還流して 3.5 時間反応させた。反応後 10 メタノール (80 ml)を加えて室温にて、1.5 時間攪拌し反応液を濃縮する。残液を n-ヘキサン-酢酸エチルを用いてシリカゲルクロマトを行った。油状の 1-ブチル-3-ブチル-6-メチル-2-チオピリドン (2-026) (12.97 g)を得、精製することなく次の反応に用いた。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.94 (t, J = 7.5Hz, 3H), 0.99 (t, J = 7.5Hz, 3H),

15 1.46 (m, 4H), 1.87 (m, 4H), 2.50 (s, 3H), 3.98 (t, J = 6.9Hz, 2H), 4.75 (brs, 2H), 6.40 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.80 (d, J = 7.8Hz, 1H)

#### b) 1-ブチル 3-ハイドロキシ 6-メチル-2-チオピリドン(2-018)の合成

1-ブチル 3-ブチル-6-メチル-2-チオピリドン (2-026) (12.97g)を乾燥塩化メチレン (200 ml)に溶かし 1 mmol/ml の三臭化ホウ素-塩化メチレン溶液 (5.6 ml)をゆっくりと加え、室温にて 5 時間攪拌反応させた。反応液を 150 ml の氷水に注加し濃アンモニアにて pH 8-9 としクロロホルムにて抽出、飽和食塩水にて洗浄しアルミナ(150 g)のカラムを通しさらにクロロホルムにて溶出した。オレンジ色の油状物として 1-ブチル 3-ハイドロキシ 6-メチル-2-チオピリドン (2-018) (5.439 g,

73.4%)を得た。

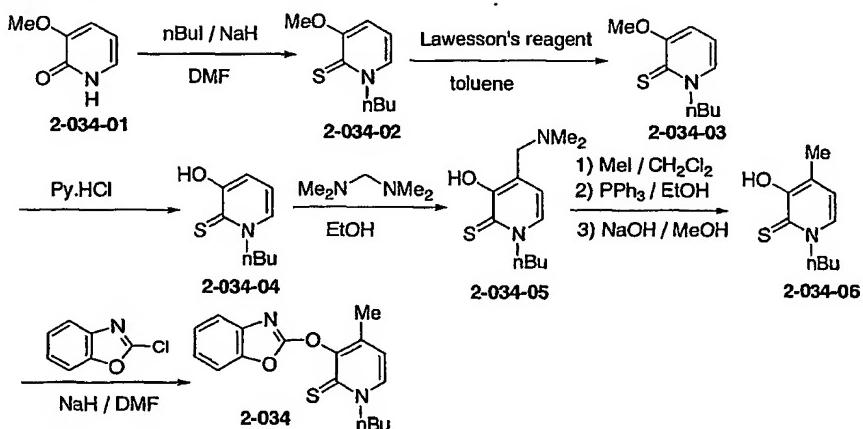
<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 1.02 (t, J = 7.8 Hz), 1.50 (m, 2H), 1.85 (m, 2H), 2.51 (s, 3H), 4.66 (br s, 2H), 6.49 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 6.91 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.44(brs, 1H).

5 c) 1-ブチル 3-(ベンズオキサゾール 2-イル)-オキシ-6-メチル-2-チオピリドン (2-014)の合成

1-ブチル 3-ハイドロキシ 6-メチル-2-チオピリドン (2-018) (113 mg)を乾燥 DMF (1.1 ml)に溶かし、この中に 60%水素化ナトリウム(36 mg)を加えて室温にて 30 分攪拌した。2-クロロベンゾオキサゾール (112 mg)を加え 2 時間 40 分反応 10 した。反応後氷水 (20 ml)に加え酢酸エチル(30 ml)にて 2 回抽出し、有機層は飽和食塩水にて洗浄し濃縮した。残渣をクロロホルムを展開溶媒とした分取薄層クロマトにて精製し、エーテルより再結晶して 1-ブチル 3-(ベンズオキサゾール 2-イル)-オキシ-6-メチル-2-チオピリドン (2-014) (117 mg, 融点 125-127.5°C)を得た。

15 実施例 2-015～実施例 2-029 は、実施例 2-014 に準拠した方法にて合成した。

#### <実施例 2-034>



#### a) 1-ブチル-3-メトキシ 2-ピリドン (2-034-02)の合成

20 3-メトキシ 2(1*H*)-ピリドン (2-034-01) (5.0 g) の DMF (40 ml) 溶液に、室温で水素化ナトリウム (60%wt, 2.2 g) を加えた。20 分攪拌した後、1-ヨードブタ

ン(15.5 g)を加え、さらに40分攪拌した。水を加え反応を停止した後、溶媒を留去した。残渣に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加え有機相を分離した後、水相を酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機相を水、飽和食塩水で順次洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去し、得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィー(トルエン/アセトン = 4/1)で精製することにより1-ブチル-3-メトキシ2-ピリドン(2-034-02)(6.7 g, 93%)を油状物質として得た。

15  $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  0.93 (t,  $J = 7.2$  Hz, 2H), 1.30-1.42 (m, 2H),  
1.68-1.78 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.97 (t,  $J = 7.2$  Hz, 2H), 6.09 (t,  $J = 7.2$  Hz, 1H),  
6.59 (dd,  $J = 7.2, 1.5$  Hz, 1H), 6.88 (dd,  $J = 7.2, 1.5$  Hz, 1H).

10 b) 1-ブチル-3-メトキシピリジン-2-チオン(2-034-03)の合成

1-ブチル-3-メトキシ2-ピリドン(2-034-02)(6.4 g)のトルエン(150 ml)溶液にローソン試薬(16.8 g)を加え、加熱還流した。3時間攪拌した後、室温でメタノール(100 ml)を加え、さらに30分攪拌した。減圧下で溶媒を留去した後、水、及び酢酸エチルを加え有機相を分離し、水相を酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機相を、水、及び飽和食塩水で洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去した後、得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィー(トルエン/アセトン = 4/1)で精製することにより1-ブチル-3-メトキシピリジン-2-チオン(2-034-03)(5.6 g, 80%)を油状物質として得た。

20  $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  0.98 (t,  $J = 7.3$  Hz, 3H), 1.36-1.48 (m, 2H), 1.84-  
1.94 (m, 2H), 3.92 (s, 3H), 4.62 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 6.61 (dd,  $J = 7.9, 6.2$  Hz, 1H),  
6.69 (dd,  $J = 7.9, 1.2$  Hz, 1H), 7.38 (dd,  $J = 6.2, 1.2$  Hz, 1H).

25 c) 1-ブチル-3-ヒドロキシピリジン-2-チオン(2-034-04)の合成

1-ブチル-3-メトキシピリジン-2-チオン(2-034-03)(1.4 g)にピリジン塩酸塩(3.6 g)を加えた。190 °Cで40分攪拌した後、水、及び酢酸エチルを加え有機相を分離し、水相を酢酸エチルでさらに3回抽出した。合わせた有機相を、水、及び飽和食塩水で洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去す

ることにより 1-ブチル-3-ヒドロキシピリジン-2-チオン (2-034-04) (1.02 g, 78%) を油状物質として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.99 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.43 (m, 2H), 1.91 (m, 2H), 4.53 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 6.66 (dd, J = 7.6, 6.7 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 7.6, 1.2 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 6.7, 1.2 Hz, 1H), 8.61 (br s, 1H).

5 d) 1-ブチル-3-ヒドロキシ-4-(N,N-ジメチルアミノメチル)ピリジン-2-チオン (2-034-05) の合成

1-ブチル-3-ヒドロキシピリジン-2-チオン (2-034-04) (1.0 g) の 10%含水エタノール (20 ml) 溶液に, 室温で N,N,N',N'-テトラメチルジアミノメタン (1.70 g) 10 を加えた。75 °Cで 24 時間攪拌した後, 減圧下で溶媒を留去することにより 1-ブチル-3-ヒドロキシ-4-(N,N-ジメチルアミノメチル)ピリジン-2-チオン (2-034-05) (1.3 g, 95%) を油状物質として得た。

15 <sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.99 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.39-1.47 (m, 2H), 1.86-1.93 (m, 2H), 2.29 (s, 6H), 3.48 (s, 2H), 4.51 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 6.87 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 6.7 Hz, 1H).

e) 1-ブチル-3-ヒドロキシ-4-メチルピリジン-2-チオン (2-034-06)の合成

1-ブチル-3-ヒドロキシ-4-(N,N-ジメチルアミノメチル)ピリジン-2-チオン (2-034-05) (1.0 g) の塩化メチレン (20 ml) 溶液に室温でヨードメタン (2.1 g) を加えた。1 時間攪拌した後, 減圧下で溶媒を留去した。残渣にエタノール (20 ml), 20 及びトリフェニルホスフィン (1.6 g) を加えた。75 °Cで 20 時間攪拌した後, 減圧下で溶媒を留去した。次に, 残渣にメタノール (10ml), 及び 1 規定水酸化ナトリウム水溶液 (8 ml) を加え, さらに 60 °Cで 2 時間攪拌した。減圧下で溶媒を留去した後, 得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィー (トルエン/アセトン = 4/1) で精製することにより 1-ブチル-3-ヒドロキシ-4-メチルピリジン-2-チオン (2-034-06) (0.57 g, 70%) を油状物質として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.98 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.36-1.48 (m, 2H), 1.84-1.94 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 4.50 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 6.55 (d, J = 6.7 Hz, 1H),

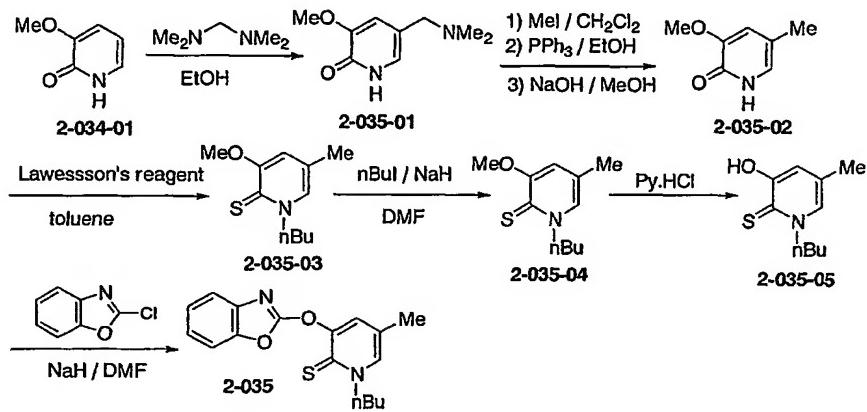
7.25 (d,  $J = 6.7$  Hz, 1H), 8.67 (s, 1H).

f) 3-(ベンゾオキサゾール 2-イルオキシ)-1-ブチル-4-メチルピリジン-2-チオン (2-034) の合成

1-ブチル-3-ヒドロキシ-4-メチルピリジン-2-チオン (2-034-06) (50 mg) の  
5 DMF (1.0 ml) 溶液に、室温で水素化ナトリウム (60%wt, 15 mg) を加えた。20 分攪拌した後、2-クロロベンゾオキサゾール (85 mg) を加え、さらに 75 °C で 17 時間攪拌した。水を加え反応を停止した後、溶媒を留去した。残渣に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加え有機相を分離した後、水相を酢酸エチルで 3 回抽出した。合わせた有機相を水、飽和食塩水で順次洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去し、得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィー (トルエン/アセトン = 4/1) で精製することにより 3-(ベンゾオキサゾール 2-イルオキシ)-1-ブチル-4-メチルピリジン-2-チオン (2-034) (73 mg, 92%) を黄色結晶として得た。得られた結晶をさらに再結晶 (塩化メチレン-エーテル) により精製した。

15

<実施例 2-035>



a) 5-(*N,N*-ジメチルアミノメチル)-3-メトキシ 2(1*H*)-ピリドン (2-035-01)の合成

3-メトキシ 2(1*H*)-ピリドン (2-034-01) (5.0 g) の 10%含水エタノール (150 ml)  
20 溶液に、室温で *N,N,N',N'*-テトラメチルジアミノメタン (54 ml) を加え、加熱還流した。48 時間攪拌した後、減圧下で溶媒を留去し得られた粗生成物をカラムク

ロマトグラフィー (クロロホルム/メタノール/水 = 6/4/1) で精製することにより  
5-(*N,N*-ジメチルアミノメチル)-3-メトキシ 2(1*H*)-ピリドン (2-035-01) (4.5 g,  
53%) を油状物質として得た。

5       $^1\text{H}$  NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>):  $\delta$  2.21 (s, 6H), 3.17 (s, 2H), 3.87 (s, 3H), 6.86 (d,  $J$   
= 1.8 Hz, 1H), 6.90 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H).

b) 3-メトキシ 5-メチル-2(1*H*)-ピリドン (2-035-02)の合成

2-034-06 と同様にして合成した (71%)。

10      $^1\text{H}$  NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>):  $\delta$  2.11 (d,  $J$  = 1.2 Hz, 3H), 3.84 (s, 3H), 6.62 (d,  $J$   
= 2.1 Hz, 1H), 6.80 (dd,  $J$  = 2.1, 1.2 Hz, 1H).

c) 1-ブチル-3-メトキシ 5-メチル-2-ピリドン (2-035-03)の合成

2-034-02 と同様にして合成した (63%)。

15      $^1\text{H}$  NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>):  $\delta$  0.94 (t,  $J$  = 7.3 Hz, 3H), 1.29-1.42 (m, 2H),  
1.66-1.76 (m, 2H), 2.08 (d,  $J$  = 1.2 Hz, 3H), 3.80 (s, 3H), 3.92 (t,  $J$  = 7.3 Hz, 2H),  
6.45 (d,  $J$  = 1.2 Hz, 1H), 6.65 (dd,  $J$  = 2.1, 1.2 Hz, 1H).

d) 1-ブチル-3-メトキシ 5-メチルピリジン-2-チオノン (2-035-04)の合成

2-034-03 と同様にして合成した (100%)。

16      $^1\text{H}$  NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>):  $\delta$  0.97 (t,  $J$  = 7.4 Hz, 3H), 1.35-1.48 (m, 2H),  
1.83-1.93 (m, 2H), 2.21 (s, 3H), 3.91 (s, 3H), 4.59 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 6.55 (s,  
1H), 7.21 (s, 1H).

e) 1-ブチル-3-ヒドロキシ-5-メチルピリジン-2-チオノン (2-035-05)の合成

2-034-04 と同様にして合成した (76%)。

17      $^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz):  $\delta$  0.99 (t,  $J$  = 7.3 Hz, 3H), 1.37-1.50 (m, 2H),  
1.85-1.95 (m, 2H), 2.19 (d,  $J$  = 0.9 Hz, 3H), 4.49 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 6.86 (d,  $J$ =  
1.2 Hz, 1H), 7.16 (dd,  $J$  = 1.9, 0.9 Hz, 1H), 8.55 (s, 1H).

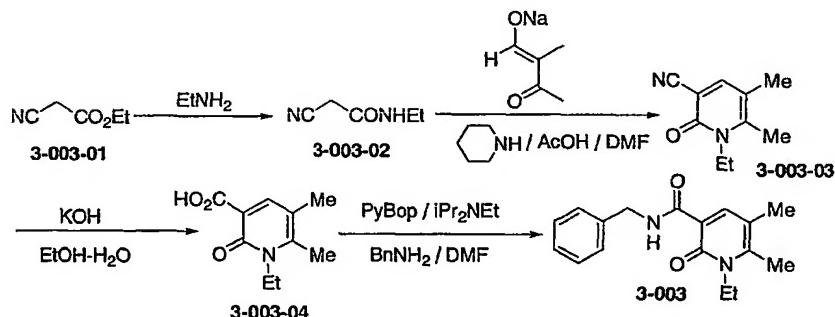
f) 3-(ベンゾオキサゾール 2-イルオキシ)-1-ブチル-5-メチルピリジン-2-チオノン  
(2-035)の合成

1-ブチル-3-ヒドロキシ-5-メチルピリジン-2-チオノン (2-035-05) (300 mg) の

DMF (6.0 ml) 溶液に、室温で水素化ナトリウム (60%wt, 79 mg) を加えた。20 分攪拌した後、2-クロロベンゾオキサゾール (432 mg) を加え、さらに室温で 2 時間攪拌した。水を加え反応を停止した後、溶媒を留去した。残渣に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加え有機相を分離した後、水相を酢酸エチルで 3 回抽出した。合わせた有機相を水、飽和食塩水で順次洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去し、得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィー (トルエン/アセトン = 4/1) で精製することにより 3-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ)-1-ブチル-4-メチルピリジン-2-チオン (2-035) (372 mg, 78%) を黄色結晶として得た。得られた結晶をさらに再結晶 (塩化メチレン-エーテル) により精製した。

実施例 2-030～実施例 2-037 は、実施例 2-034、2-035 と同様に合成した。

<実施例 3-003>



a) *N*-エチル シアノアセタミド (3-003-02)

15 エチルシアノアセタート (3-003-01) (11.31g) に室温攪拌下、70% エチルアミン水溶液 (15.5ml) を滴下した。この時、内温が 44°C に上昇したので、水冷攪拌し 15 分を要し 32～37°C で行った。そのまま 9 時間攪拌後、一晩室温放置した。翌日、反応液を減圧留去した。得られた褐色結晶性残渣 (11.93g) にエーテル (20ml) と n-ヘキサン (10ml) を加え、オレンジ色結晶をろ取し *N*-エチル シアノアセタミド (3-003-02) (9.05g, 80.7%, 融点 54-59°C) を得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 1.20 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 3.31-3.40 (m, 4H), 6.22 (br s, 1H).

## b) 1-エチル 3-シアノ-5,6-ジメチル-2-ピリドン (3-003-03)

2-メチル-3-オキソブタナール ナトリウム塩 (3.18g)と *N*-エチル シアノアセタミド (3-003-02)(2.248g)を DMF(20ml)に懸濁し、室温攪拌下、酢酸(1.49ml)、続いてビペリジン(0.40ml)を加え入れ、135°C油浴中で攪拌還流を行った。5時間後、反応混合物をクロロホルムと水に溶解しクロロホルムで3回抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去した。得られた結晶性残渣(4.07g)をn-ヘキサン(15ml)で3回洗浄し、1-エチル 3-シアノ-5,6-ジメチル-2-ピリドン (3-003-03) (3.38g, 96%)を褐色結晶として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 1.33 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H), 2.13 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 4.19 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 7.59 (s, 1H).

## c) 1-エチル 3-カルボキシ-5,6-ジメチル-2-ピリドン (3-003-04)

1-エチル 3-シアノ-5,6-ジメチル-2-ピリドン (3-003-03) (3.37g)を80%エタノール(65ml)に溶解し、水酸化カリウム (7.96g)を加え、窒素気流中、102°C油浴中で攪拌還流を行った。24時間後、反応液を減圧濃縮し水 (50ml)と酢酸エチル(50ml)を加え、氷冷攪拌後、振とう分液し水層を氷冷下、濃塩酸 (13ml)を加え入れ、析出した結晶をろ取し冷水で洗浄し、1-エチル 3-カルボキシ-5,6-ジメチル-2-ピリドン (3-003-04) (2.734g, 73.3%, 融点 164-165°C.)を黄土色結晶として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 1.38 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.49 (s, 3H), 4.28 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 8.28 (s, 1H), 14.73 (br s, 1H).

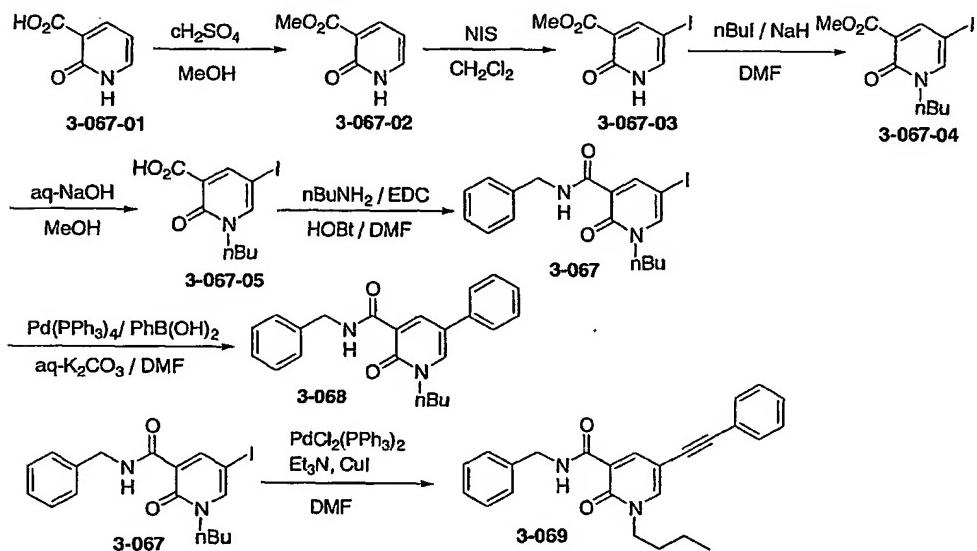
## d) 1-エチル-2-オキソ-5,6-ジメチル-1,2-ジヒドロピリジン 3-カルボン酸 ベンジルアミド (3-003)

1-エチル 3-カルボキシ-5,6-ジメチル-2-ピリドン (3-003-04) (195mg)をDMF(3ml)に溶解し、ベンジルアミン(0.17ml)、ジイソプロピルエチルアミン(0.35ml)、次いでベンゾトリアゾール 1-イル-トリス-ピロジリノ-ホスホニウムヘキサフルオロホスフェイト(PyBOP, 624mg)を加え入れ、室温攪拌を行った。1時間後、反応液を酢酸エチルで希釈し、塩酸水溶液で2回洗浄し、続いて重曹水溶液2回洗浄し、更に水洗1回行い硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去した。残

渣(0.40g)をシリカゲルカラムクロマト(30g, クロロホルム)を行い、1-エチル-2-オキソ-5,6-ジメチル-1,2-ジヒドロピリジン 3-カルボン酸 ベンジルアミド (3-003)の結晶(259mg, 91.1%)を得、塩化メチレン/n-ヘキサンで再結晶し、無色針状晶(207mg, 72.9%, 融点 117°C)を得た。

5 実施例 3-001～実施例 3-036 は、実施例 3-004 と同様に合成した。

<実施例 3-067、3-068、3-069>



a) 2-ヒドロキシニコチン酸 メチルエステル (3-067-02) の合成

10 2-ヒドロキシニコチン酸 (3-067-01) (50 g) のメタノール (500 ml) 溶液に、室温で濃硫酸 (15 ml) 及びトルエン (100 ml) を加えた。ディーンスターク還流管を取り付け 28 時間攪拌した後、炭酸カリウム水溶液を加え中和した後、溶媒を留去した。残渣に飽和塩化アンモニウム水溶液とクロロホルムを加え有機相を分離した後、水相をクロロホルムで 3 回抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。  
15 溶媒を減圧下で留去することにより 2-ヒドロキシニコチン酸メチルエステル (3-067-02) (46 g, 84%) を白色固体として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 3.92 (s, 3H), 6.45 (dd, *J* = 7.3, 6.4 Hz, 1H), 7.78 (dd, *J* = 6.4, 2.4 Hz, 1H), 8.29 (dd, *J* = 7.3, 2.4 Hz, 1H).

b) 2-ヒドロキシ-5-ヨードニコチン酸 メチルエステル (3-067-03) の合成

2-ヒドロキシニコチン酸 メチルエステル (3-067-02) (20 g) の塩化メチレン (500 ml) 溶液に、室温で N-ヨードサクシンイミド (NIS, 38 g) を加え、加熱還流した。16 時間攪拌した後、溶媒を留去し残渣に酢酸エチル (200 ml) を加え、さらに 2 時間加熱還流した。反応液に不溶の固体を濾別することにより 2-ヒドロキシ-5-ヨードニコチン酸 メチルエステル (3-067-03) (30g, 81%) を白色固体として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 3.97 (s, 3H), 8.33 (brs, 1H), 8.43 (d, *J* = 2.4 Hz, 1H).

c) 1-ブチル-5-ヨード 2-オキソ-1,2-ジヒドロビリジン 3-カルボン酸 メチルエステル (3-067-04) の合成

2-034-02 と同様にして合成した (89%)。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.96 (t, *J* = 7.4 Hz, 3H), 1.31-1.44 (m, 2H), 1.69-1.79 (m, 2H), 3.90 (s, 3H), 3.94 (t, *J* = 7.4 Hz, 2H), 7.71 (d, *J* = 2.8 Hz, 1H), 8.24 (d, *J* = 2.8 Hz, 1H).

e) 1-ブチル-5-ヨード 2-オキソ-1,2-ジヒドロビリジン 3-カルボン酸 (3-067-05) の合成

3-003-04 と同様にして合成した (89%)。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.99 (t, *J* = 7.4 Hz, 3H), 1.35-1.47 (m, 2H), 1.74-1.84 (m, 2H), 4.05 (t, *J* = 7.5 Hz, 2H), 7.83 (d, *J* = 2.7 Hz, 1H), 8.63 (d, *J* = 2.7 Hz, 1H), 14.13 (s, 1H).

d) 1-ブチル-5-ヨード 2-オキソ-1,2-ジヒドロビリジン 3-カルボン酸 ベンジルアミド (3-067) の合成

3-003 と同様にして合成した (82%)。

実施例 3-037、3-038 は、実施例 3-067 と同様に合成した。

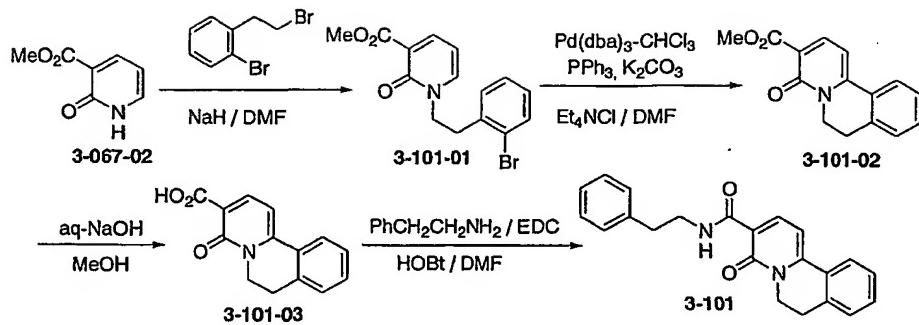
e) 1-ブチル-2-オキソ-5-フェニル-1,2-ジヒドロビリジン 3-カルボン酸 ベンジルアミド (3-068) の合成

1-ブチル-5-ヨード 2-オキソ-1,2-ジヒドロビリジン 3-カルボン酸 ベンジルアミ

- ド (3-067) (100 mg) の DMF (2.0 ml) 溶液に、室温で  $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$  (20 mg)、フェニルホウ酸 (89 mg)、及び炭酸カリウム水溶液 (2M, 0.24 ml) を加えた。90 °C で 18 時間攪拌した後、飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加え有機相を分離した。水相を酢酸エチルで 3 回抽出した後、合わせた有機相を水、飽和食塩水で順次洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去し、得られた粗生成物を分取薄層クロマトグラフィー (トルエン/アセトン = 7/1) で精製することにより 1-ブチル-2-オキソ-5-フェニル-1,2-ジヒドロピリジン 3-カルボン酸 ベンジルアミド (3-068) (77 mg, 88%) を油状物質として得た。
- f) 1-ブチル-2-オキソ-5-フェニルエチニル-1,2-ジヒドロピリジン 3-カルボン酸 ベンジルアミド (3-069) の合成
- 1-ブチル-5-ヨード 2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン 3-カルボン酸 ベンジルアミド (3-067) (78 mg) の DMF (2.0 ml) 溶液に、室温で  $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$  (15 mg)、フェニルアセチレン (89 mg)、CuI (11 mg)、及びトリエチルアミン (48 mg) を加えた。90 °C で 18 時間攪拌した後、飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加え有機相を分離した。水相を酢酸エチルで 3 回抽出した後、合わせた有機相を水、飽和食塩水で順次洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去し、得られた粗生成物を分取薄層クロマトグラフィー (トルエン/アセトン = 7/1) で精製することにより 1-ブチル-2-オキソ-5-フェニルエチニル-1,2-ジヒドロピリジン 3-カルボン酸 ベンジルアミド (3-068) (65 mg, 89%) を油状物質として得た。

実施例 3-039～実施例 3-044 と実施例 3-061～実施例 3-066 は、実施例 3-067、3-068 と同様に合成した。

<実施例 3-101>



a) 2-ヒドロキシ-1-(2-ブロモフェニル)ニコチン酸 メチルエステル (3-101-01)  
の合成

2-034-02 と同様にして合成した (59%)。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 3.25 (t, *J* = 7.2 Hz, 2H), 3.93 (s, 3H), 4.23 (t, *J* = 7.2 Hz, 2H), 6.09 (t, *J* = 7.5 Hz, 1H), 7.08-7.23 (m, 4H), 7.56 (dd, *J* = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 8.15 (dd, *J* = 7.5, 2.4 Hz, 1H).

b) 4-オキソ-6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-3-カルボン酸 メチルエステル (3-101-02)の合成

10 1-018-01と同様にして合成した(42%)。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 3.01 (t, *J* = 6.7 Hz, 2H), 3.93 (s, 3H), 4.35 (t, *J* = 6.7 Hz, 2H), 6.76 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 7.32 (dd, *J* = 7.8, 1.2 Hz, 1H), 7.39 (ddd, *J* = 7.6, 7.3, 1.5 Hz, 1H), 7.46 (ddd, *J* = 7.9, 7.6, 1.2 Hz, 1H), 7.78 (dd, *J* = 7.9, 1.5 Hz, 1H), 8.25 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H).

15 c) 4-オキソ-6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-3-カルボン酸 (3-101-03)の合成

4-オキソ-6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-3-カルボン酸 メチルエステル (3-101-02) (252 mg) のジオキサン (2.0 ml) 溶液に、室温で 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (2.0 ml) を加えた。1 時間攪拌した後、反応液をエーテルで洗浄し濃塩酸で酸性にした。水、及び酢酸エチルを加え有機相を分離した後、水相を酢酸エチルでさらに 3 回抽出し、合わせた有機相を水、飽和食塩水で順次洗い無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去することにより 4-オキソ-

6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-3-カルボン酸 (3-101-03) (209 mg, 88%)

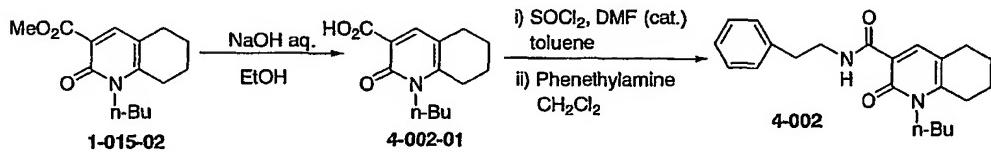
を白色固体として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 3.10 (t, J = 6.7 Hz, 2H), 4.42 (t, J = 6.7 Hz, 2H), 7.05 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.41-7.56 (m, 2H), 7.84 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.56 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 14.40 (s, 1H).

d) 4-オキソ-6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-3-カルボン酸 フェネチルアミド (3-101)の合成

4-オキソ-6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-3-カルボン酸 (3-101-03) (76 mg) の DMF (2.0 ml) 溶液に、室温で 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロビル) カルボジイミド塩酸塩(EDC, 83 mg)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール (HOBr, 58 mg)、及びフェネチルアミン (80 mg) を加えた。18 時間攪拌した後、0.5 規定塩酸で反応を停止し、酢酸エチルを加え有機相を分離した。水相を酢酸エチルでさらに 3 回抽出した後、合わせた有機相を水、飽和食塩水で順次洗い無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下で溶媒を留去し、得られた粗結晶を再結晶することにより 4-オキソ-6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-3-カルボン酸 フェネチルアミド (3-101) (84 mg, 74%) を黄色結晶として得た。

#### <実施例 4-002>



a) 1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-カルボン酸 (4-002-01)の合成

1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸メチルエステル (1-015-02) (263 mg, 1 mmol)をエタノール (6 ml)に溶解し、水酸化ナトリウム水溶液 (2M, 0.6 ml, 1.2 mmol)を加え、室温で 30 分攪拌した。反応液に希塩酸 (0.4N, 6 ml)を加え酢酸エチル (25 ml)で抽出、水層はさらに食塩で塩析

した後、酢酸エチル (25 ml)で抽出、有機層は合一して無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた結晶性残渣をヘキサンから再結晶し、1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-カルボン酸 (4-002-01) (220 mg, 88%)を白色結晶として得た。

5       $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  1.00 (t,  $J=7.5$  Hz, 3H), 1.46 (sextet,  $J=7.5$  Hz, 2H), 1.68-1.73 (m, 2H), 1.77 (quint,  $J=6.0$  Hz, 2H), 1.92 (quint,  $J=6.0$  Hz, 2H), 2.65 (t,  $J=6.0$  Hz, 2H), 2.80 (t,  $J=6.0$  Hz, 2H), 4.10 (t,  $J=7.8$  Hz, 2H), 8.22 (s, 1H), 14.82 (s, 1H).

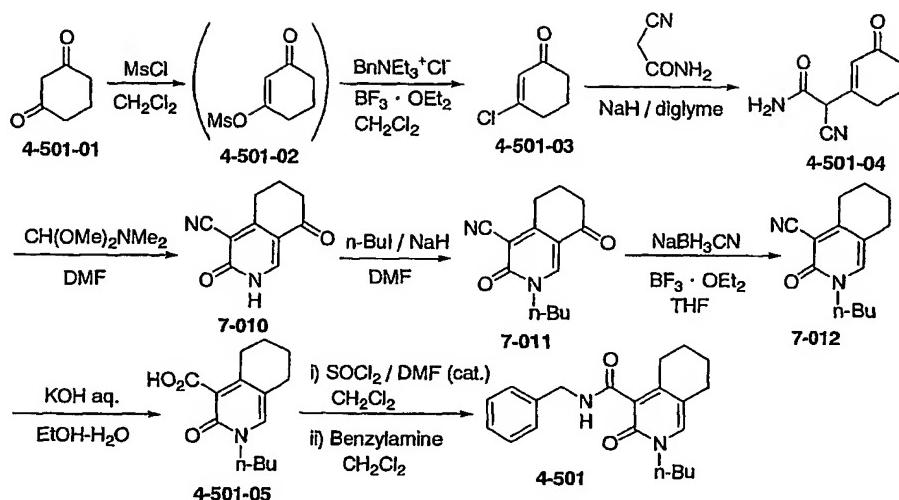
b) 1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-カルボン酸フェニチルアミド (4-002)の合成

10     1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-カルボン酸 (4-002-01) (100 mg, 0.38 mmol)をトルエン (10 ml)に溶解し、塩化チオニル (83  $\mu\text{l}$ , 1.14 mmol)と触媒量の DMF を加え、75°Cで30分反応させた。この反応液を減圧濃縮し、残渣を塩化メチレン (5 ml)に溶解した後、フェニチルアミン (143  $\mu\text{l}$ , 1.14 mmol)を加え室温で10分攪拌する。反応液に希塩酸 (1N, 10 ml)を加え酢酸エチル (30 ml)で抽出後、飽和食塩水 (10 ml)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、エーテルから再結晶して1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-カルボン酸フェニチルアミド (4-002) (100 mg, 74%)を白色結晶として得た。

15      $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  0.99 (t,  $J=7.5$  Hz, 3H), 1.45 (sextet,  $J=7.5$  Hz, 2H), 1.63 (quint,  $J=7.5$  Hz, 2H), 1.74 (quint,  $J=6.0$  Hz, 2H), 1.88 (quint,  $J=6.0$  Hz, 2H), 2.62 (t,  $J=6.0$  Hz, 2H), 2.74 (t,  $J=6.0$  Hz, 2H), 2.93 (t,  $J=7.8$  Hz, 2H), 3.66 (dt,  $J=9.0$  Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.03 (t,  $J=7.8$  Hz, 2H), 7.20-7.33 (m, 5H), 20     8.25 (s, 1H), 10.05 (br t,  $J=6.0$  Hz, 1H).

実施例 4-001～実施例 4-310 は、実施例 3-002 と同様に合成した。

## &lt;実施例 4-501&gt;



## a) 3-クロロ-2-シクロヘキセン-1-オン (4-501-03)の合成

1,3-シクロヘキサンジオン (4-501-01) (8.72 g, 77.6 mmol)を塩化メチレン (400 ml)に溶解し、メタンスルホニルクロリド (6 ml, 77.6 mmol)と炭酸カリウム (32 g, 232 mmol)を加え、室温で 2 時間攪拌した。反応液を塩化メチレン (1.4 l) と水 (400 ml)の混合液に加え分液し有機層は飽和食塩水 (400 ml)で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し全体量が 300ml になるまで減圧濃縮した。このメシリト体(1)の塩化メチレン溶液に塩化ベンジルトリエチルアンモニウム (25 g, 110 mmol)とボロントリフルオリドエチルエーテルコンプレックス (1.9 ml, 15.4 mmol)を加え、室温で 1.5 時間攪拌した。反応液を塩化メチレン (0.8 l)と水 (400 ml)の混合液に加え分液し有機層は飽和食塩水 (400 ml)で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製して 3-クロロ-2-シクロヘキセン-1-オン (4-501-03) (7.24 g, 72%)を黄色油状物質として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 2.09 (quint, *J*= 6.0 Hz, 2H), 2.40 (t, *J*= 6.6 Hz, 2H), 2.69 (td, *J*= 6.0 Hz, 1.5 Hz, 2H), 6.23 (t, *J*= 1.5 Hz, 1H).

## b) 3-シアノアセタミド-2-シクロヘキセン-1-オン (4-501-04)の合成

2-シアノアセタミド (4.42 g, 52.8 mmol)をジグライム (50 ml)に溶解し、水素

化ナトリウム (60% oil suspension, 2.1 g, 52.8 mmol)を加え室温で 5 分間激しく攪拌した。この溶液に 3-クロロ-2-シクロヘキセン-1-オン (4-501-03) (6.24 g, 48 mmol)のシグライム溶液 (60 ml)を徐々に加え、室温で 2.5 時間攪拌し、さらに 2-シアノアセタミド (1.6 g, 19.2 mmol)と水素化ナトリウム (60% oil suspension, 5 0.76 g, 19.2 mmol)を加え室温で 1.5 時間攪拌した。反応液に希塩酸 (1N, 100 ml)を加え酢酸エチル (300 ml)で抽出した。水層はさらに食塩で塩析した後、酢酸エチル (300 ml)で抽出、有機層は合一して無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた結晶性残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、ヘキサンから再結晶して 3-シアノアセタミド-2-シクロヘキセン-1-オン (4-501-04) (6.5 g, 76%)を白色結晶として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, *d*<sub>6</sub>-DMSO) : δ 1.71 (quint, *J*= 6.0 Hz, 2H), 1.79 (quint, *J*= 6.0 Hz, 2H), 2.78 (t, *J*= 6.0 Hz, 2H), 5.90 (s, 1H), 6.90 (s, 1H), 11.16 (br d, *J*= 1.5 Hz, 2H).

c) 3,8-ジオキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-010)の合成

3-シアノアセタミド-2-シクロヘキセン-1-オン (4-501-04) (1.25 g, 7 mmol)を DMF (25 ml)に溶解し N, N'-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール (1.1 ml, 8.4 mmol)を加え室温で 70 時間攪拌した。反応液に希塩酸 (1N, 100 ml)を加え酢酸エチル (300 ml)で抽出した。水層はさらに食塩で塩析した後、酢酸エチル (300 ml)で抽出、有機層は合一して無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた結晶性残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、トルエンから再結晶して 3,8-ジオキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-010) (0.92 g, 70%)を淡褐色結晶として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub> + (a small amount of CD<sub>3</sub>OD)) : δ 2.17 (quint, *J*= 6.3 Hz, 2H), 2.63 (t, *J*= 6.3 Hz, 2H), 3.09 (t, *J*= 6.3 Hz, 2H), 8.34 (s, 1H).

d) 2-ブチル-3,8-ジオキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-011)の合成

3,8-ジオキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-010) (770 mg, 4.1 mmol)を DMF (15 ml)に溶解し、1-ヨードブタン (0.51 ml, 4.5 mmol)と水素化ナトリウム (60% oil suspension, 180 mg, 4.5 mmol)を加え、室温で3時間攪拌した。反応液に希塩酸 (1N, 60 ml)を加え酢酸エチル (150 ml)で抽出後、飽和食塩水 (50 ml)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮する。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、2-ブチル-3,8-ジオキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-011) (610 mg, 61%)を白色結晶として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.97 (t, *J*= 7.5 Hz, 3H), 1.38 (sextet, *J*= 7.5 Hz, 2H), 1.76 (quint, *J*= 7.5 Hz, 2H), 2.15 (quint, *J*= 6.3 Hz, 2H), 2.61 (t, *J*= 6.3 Hz, 2H), 3.06 (t, *J*= 6.3 Hz, 2H), 4.03 (t, *J*= 7.5 Hz, 2H), 8.39 (s, 1H).  
e) 2-ブチル-3-オキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-012)の合成

2-ブチル-3,8-ジオキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-011) (100 mg, 0.41 mmol)を THF (7 ml)に溶解し、ボロントリフルオリドエチルエーテル錯体 (0.21 ml, 1.64 mmol)と水素化シアノホウ素ナトリウム (90 mg, 1.44 mmol)を加え、室温で30分攪拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (30 ml)を加え酢酸エチル (60 ml)で抽出後、飽和食塩水 (30 ml)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、2-ブチル-3-オキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-012) (70 mg, 74%)を白色粉末として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.96 (t, *J*= 7.5 Hz, 3H), 1.37 (sextet, *J*= 7.5 Hz, 2H), 1.67-1.86 (m, 6H), 2.54 (t, *J*= 6.3 Hz, 2H), 2.87 (t, *J*= 6.3 Hz, 2H), 3.93 (t, *J*= 7.5 Hz, 2H), 7.22 (s, 1H).  
f) 2-ブチル-3-オキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボン酸 (4-501-05)の合成

2-ブチル-3-オキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-012) (260 mg, 1.13 mmol)を水 (6ml) / エタノール (26 ml)に溶解し、水酸化カリウム (444 mg, 7.91 mmol)を加え 24 時間加熱還流した。反応液を氷冷、希塩酸 (2N, 8 ml)を滴下し、酢酸エチル (70 ml)で抽出後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。結晶性残渣をヘキサンから再結晶して、2-ブチル-3-オキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボン酸 (4-501-05) (197 mg, 70%) を白色結晶として得た。

10     <sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.97 (t, *J*= 7.5 Hz, 3H), 1.37 (sextet, *J*= 7.5 Hz, 2H), 1.70-1.82 (m, 6H), 2.56 (t, *J*= 6.0 Hz, 2H), 2.87 (t, *J*= 6.0 Hz, 2H), 3.95 (t, *J*= 7.5 Hz, 2H), 7.27 (s, 1H).

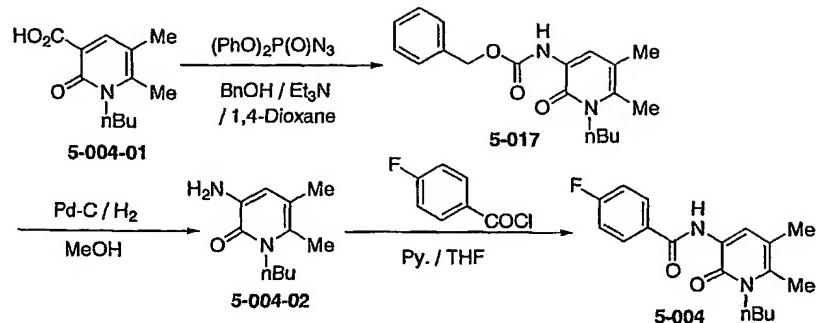
g) 2-ブチル-3-オキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボン酸ベンジルアミド (4-501)の合成

2-ブチル-3-オキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボン酸 (4-501-05) (5 mg, 0.02 mmol)をトルエン (1 ml)に溶解し、塩化チオニル (4.4 μl, 0.06 mmol)と触媒量の DMF を加え、75°C で 30 分反応させた。この反応液を減圧濃縮し、残渣を塩化メチレン (1 ml)に溶解した後、ベンジルアミン (6.2 μl, 0.06 mmol)を加え室温で 10 分攪拌した。反応液に希塩酸 (1N, 3 ml)を加え酢酸エチル (8 ml)で抽出後、飽和食塩水 (4 ml)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル) にて精製し、2-ブチル-3-オキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボン酸ベンジルアミド (4-501) (5 mg, 74%)を白色粉末として得た。

25     <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz): δ 0.95 (t, *J*= 7.5 Hz, 3H), 1.37 (sextet, *J*= 7.5 Hz, 2H), 1.66-1.77 (m, 6H), 2.57 (br t, *J*= 6.3 Hz, 2H), 3.27 (br t, *J*= 6.3 Hz, 2H), 3.92 (t, *J*= 7.5 Hz, 2H), 4.60 (d, *J*= 5.7 Hz, 2H), 7.12 (s, 1H), 7.23-7.40 (m, 5H), 9.58 (br t, *J*= 5.7 Hz, 1H).

実施例 4-502～実施例 4-504 は、実施例 4-501 と同様に合成した。

## &lt;実施例 5-004&gt;



a) 3-ベンジルオキシカルボニルアミノ-1-ブチル5,6-ジメチル-2-ピリドン (5-017) の合成

5 1-ブチル 3-カルボキシ-5,6-ジメチル-2-ピリドン (5-004-01) (2.233g)をジオキサン(50ml)に溶解し、トリエチルアミン(4.2ml)、続いてジフェニルホスホリルアジド(2.4ml)を加え入れ、窒素気流中、110°C油浴中で攪拌還流を行った。5時間後、ベンジルアルコール(1.1ml)を加え、同様に加熱攪拌を続けた。4時間後、反応液を氷水中に注入し、酢酸エチル及び塩酸水溶液を加え、振とう分液後、重曹水溶液、水洗を各1回行い硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去した。得られた残渣(3.56g)をシリカゲルカラムクロマト(ローバーカラム B, トルエン-アセトン(29:1))を行い、3-ベンジルオキシカルボニルアミノ-1-ブチル5,6-ジメチル-2-ピリドン (5-017)を黄色結晶(2.477g, 75.4%, 融点 65-66°C)で得た。

b) 3-アミノ-1-ブチル5,6-ジメチル-2-ピリドン (5-004-02) の合成

15 3-ベンジルオキシカルボニルアミノ-1-ブチル5,6-ジメチル-2-ピリドン (5-017) (2.487g)をメタノール(25ml)に溶解し 10%パラジウム炭素(373mg)の水(2.5ml)懸濁液を加え入れ、常圧にて接触還元を行った。4時間後、反応混合物をセライト上で濾過し、メタノール洗浄し減圧留去して 3-アミノ-N-1-ブチル5,6-ジメチル-2-ピリドン (5-004-02) (1.438g, 97.8%, 融点 94-97°C)を褐色結晶として得た。

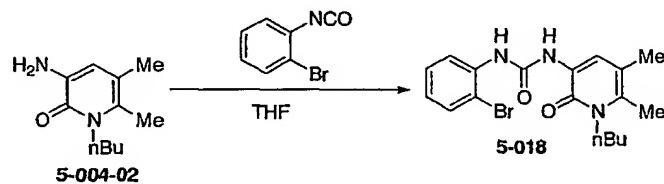
20  $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  0.97 (t,  $J = 7.2$  Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.60-1.71 (m, 2H), 4.08 (d,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 6.42 (s, 1H).

c) N-1-ブチル 3-(4-フルオロベンゾイル)アミノ-5,6-ジメチル-2-ピリドン (5-

## 004) の合成

- 3-アミノ-1-ブチル 5,6-ジメチル-2-ピリドン (5-004-02) (117mg)をピリシン (1ml)に溶解し、窒素気流中、氷冷攪拌下、4-フルオロベンゾイルクロリド(0.08ml)のテトラヒドロフラン(1ml)溶液を 10 分で滴下し、そのまま攪拌を行った。3 時  
 5 間後、反応混合物を酢酸エチルで希釈し氷水中に注入し、酢酸エチルで 1 回抽出後、塩酸水溶液、水洗、重曹水溶液、更に水洗を行い、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去した。得られた結晶性残渣(202mg)を塩化メチレン n-ヘキサンで再結晶を行い、無色針状晶の 1-ブチル 3-(4-フルオロベンゾイル)アミノ-5,6-ジメチル-2-ピリドン (5-004) (103mg, 54.2%, 融点 129-130°C)を得た。
- 10 実施例 5-001～実施例 5-017 は、実施例 5-001 と同様に合成した。

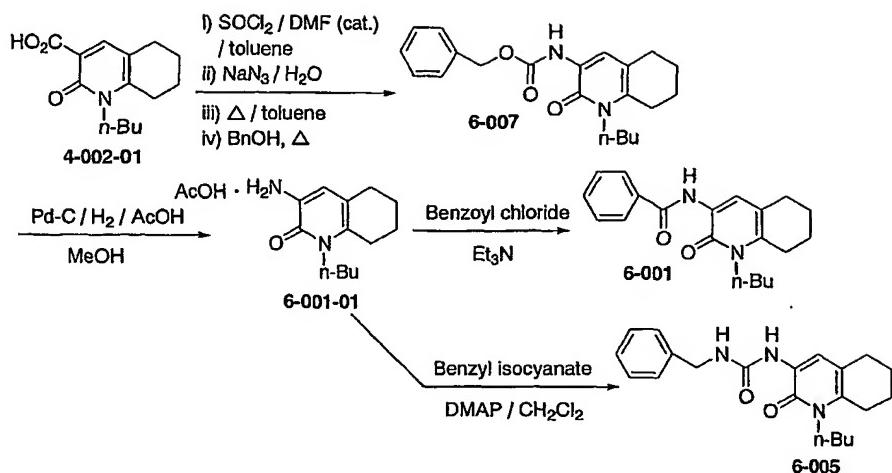
## &lt;実施例 5-018&gt;



- a) 4-(ベンゾオキサゾール 2-イルオキシ)-1-ペンジル 3-メトキシ 5,6-ジメチル-1*H*-  
 15 ピリジン-2-オン (5-018)
- 2-ブロモフェニルイソシアネート(80mg)をテトラヒドロフラン(2ml)に溶解し  
 窒素気流中、室温攪拌下、3-アミノ-1-ブチル 5,6-ジメチル-2-ピリドン (5-004-02)  
 (78mg)のテトラヒドロフラン(2ml)溶液を 10 分で滴下し一晩室温放置した。翌日  
 反応液を減圧留去し得られた結晶をジクロルメタン-エーテルで再結晶し、4-(ベン  
 20 ソオキサゾール 2-イルオキシ)-1-ペンジル 3-メトキシ 5,6-ジメチル-1*H*-ピリジン  
 -2-オン (5-018) (142mg, 89.9%, 融点 197-8°C) を得た。

実施例 5-019 は、実施例 5-018 と同様に合成した。

## &lt;実施例 6-001、6-005、6-007&gt;



a) (1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-イル)-カルバミン酸ベンジルエステル (6-007) の合成

- 1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-カルボン酸 (4-002-01) (100 mg, 0.38 mmol) をトルエン (5 ml) に溶解し、塩化チオニル (57  $\mu$ l, 0.76 mmol) と触媒量の DMF を加え、75°C で 30 分反応させた。この反応液を減圧濃縮し、残渣をアセトン (5 ml) に溶解した後、アジ化ナトリウム (29 mg, 0.42 mmol) 水溶液 (0.5 ml) を加え室温で 15 分攪拌した。反応液に水 (5 ml) を加え酢酸エチル (10 ml) で抽出後、飽和食塩水 (5 ml) で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。残渣をトルエン (5 ml) に溶解し 120°C で 30 分反応した後、ベンジルアルコール (46  $\mu$ l, 0.44 mmol) を加えさらに 120°C で 2 時間反応させた。反応液をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル) にて精製し、(1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-イル)-カルバミン酸ベンジルエステル (6-007) (90 mg, 63%) を白色泡状物質として得た。
- 15  $^1$ H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>):  $\delta$  0.96 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 3H), 1.41 (sextet,  $J$  = 7.5 Hz, 2H), 1.63 (quint,  $J$  = 7.5 Hz, 2H), 1.70 (quint,  $J$  = 6.0 Hz, 2H), 1.83 (quint,  $J$  = 6.0 Hz, 2H), 2.53 (t,  $J$  = 6.0 Hz, 2H), 2.63 (t,  $J$  = 6.0 Hz, 2H), 4.01 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 5.19 (s, 2H), 7.29-7.41 (m, 5H), 7.76 (s, 1H), 7.86 (br s, 1H).
- b) 3-アミノ-1-ブチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン酢酸塩 (6-001-01) の合成
- 20 01)

(1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-イル)-カルバミン酸ペンジルエステル (6-007) (100 mg, 0.28 mmol)をメタノール (7 ml)に溶解し、酢酸 (16  $\mu$ l, 0.28 mmol)とパラジウム炭素 (10%, 30 mg)を加え、水素雰囲気下 1.5 時間激しく攪拌した。パラジウム炭素をろ過、母液を減圧濃縮した後、結晶性残渣をヘキサンから再結晶して 3-アミノ-1-ブチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン酢酸塩 (6-001-01) (60 mg, 76%)を白色結晶として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>):  $\delta$  0.98 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.67 (quint, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.76 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.05 (s, 3H), 2.58 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.67 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 4.04 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 8.27 (s, 1H).

c) *N*-(1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-イル)-ベンズアミド (6-001)の合成

3-アミノ-1-ブチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン酢酸塩 (6-001-01) (5 mg, 0.018 mmol)を塩化メチレン (1 ml)に溶解し、ベンゾイルクロリド (2.3  $\mu$ l, 0.02 mmol)とトリエチルアミン (5.6  $\mu$ l, 0.04 mmol)を加え、室温で 10 分攪拌した。反応液に希塩酸 (0.1N, 3 ml)を加え酢酸エチル (10 ml)で抽出後、飽和食塩水 (3 ml)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、*N*-(1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-イル)-ベンズアミド (6-001) (4.9 mg, 83%)を白色泡状物質として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>):  $\delta$  0.99 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 1.87 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.60 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.69 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 4.06 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 7.43-7.56 (m, 3H), 7.94 (d, *J* = 6.9 Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 9.26 (br s, 1H).

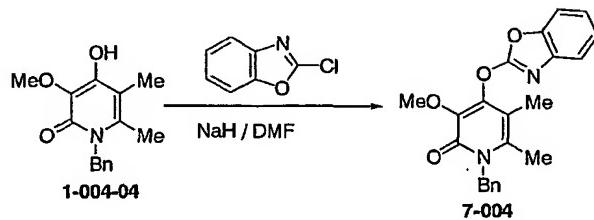
25 実施例 6-002～実施例 6-004 は、実施例 6-001 と同様に合成した。

d) 1-ベンジル 3-(1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-イル)-

ウレア (6-005)の合成

- 3-アミノ-1-ブチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン酢酸塩 (6-001) (5 mg, 0.018 mmol)を塩化メチレン (1 ml)に溶解し、ベンジルイソシアナート (2.5  $\mu$ l, 0.02 mmol)と4-ジメチルアミノピリジン (2.4 mg, 0.02 mmol)を加え、室温で  
 5 4時間攪拌した。反応液に希塩酸 (0.1N, 3 ml)を加え酢酸エチル (10 ml)で抽出後、飽和食塩水 (3 ml)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、ヘキサンから再結晶して1-ベンジル 3-(1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-キノリン-3-イル)-ウレア (6-005) (5.0 mg, 79%)を白色結晶として得た。
- 10  $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  0.92 (t,  $J=7.5$  Hz, 3H), 1.32 (sextet,  $J=7.5$  Hz, 2H), 1.57-1.65 (m, 2H), 1.69 (quint,  $J=6.0$  Hz, 2H), 1.82 (quint,  $J=6.0$  Hz, 2H), 2.55 (t,  $J=6.0$  Hz, 2H), 2.59 (t,  $J=6.0$  Hz, 2H), 3.90 (t,  $J=7.8$  Hz, 2H), 4.46 (d,  $J=6.0$  Hz, 2H), 5.72 (br s, 1H), 7.24-7.32 (m, 5H), 7.95 (s, 1H), 8.00 (br s, 1H).

15 <実施例 7-004>



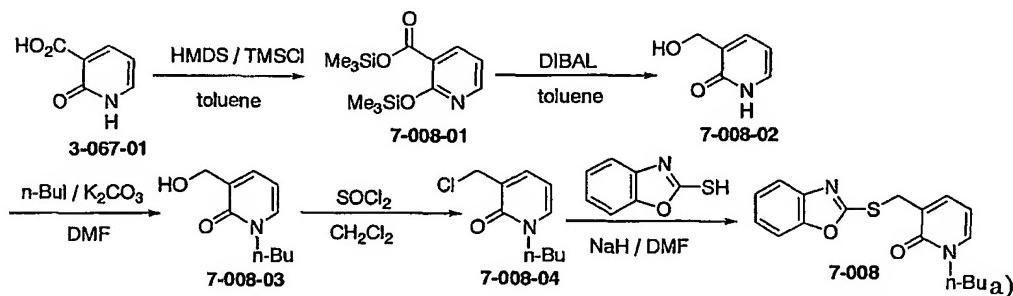
a) 1-(2-ブロモ-フェニル)-3-(1-ブチル-5,6-ジメチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-イル)-ウレア (7-004)

- 1-ベンジル 5,6-ジメチル-4-ヒドロキシ-3-メトキシ 2-ピリドン (1-004-04)  
 20 (259mg)を DMF(3ml)に溶解し、窒素気流中、室温攪拌下、60%水素化ナトリウム (48mg)を一時に加え入れ、10分後 2-クロルベンズオキサゾール(261mg)の DMF(0.5ml)溶液を加え、5時間攪拌後一晩室温放置した。反応混合物を氷水中に注入し酢酸エチルエステルで2回抽出し水洗2回行った後硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去した。得られた結晶性残渣(278mg, 73.9%)をアセトン溶解し脱色炭

処理後、エーテルを加え室温放置。析出した結晶を濾取し、1-(2-ブロモ-フェニル)-3-(1-ブチル-5,6-ジメチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロ-ビリジン-3-イル)-ウレア(7-004) (144mg, 38.3%, 融点 154~155°C) を無色プリズム晶として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 2.07 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 3.88 (s, 3H), 5.42 (br s, 2H), 7.19-7.54 (m, 9H).

<実施例 7-008>



3-ヒドロキシメチル-2(1*H*)-ピリドン (7-008-01) の合成

10 2-ヒドロキシニコチン酸 (3-067-01) (5.0 g) のトルエン (70 ml) 溶液に、室温でヘキサメチルジシラザン(HMDS, 19 ml)、及びクロロトリメチルシラン(TMScI, 0.23 ml) を加え加熱還流した。2時間攪拌した後、溶媒を留去し残渣にトルエン (100ml) を加えた。次に、水素化ジイソブチルアルミニウム (DIBAL, 2M トルエン溶液、90 ml) を -78 °Cで加え4時間攪拌した後、メタノールを加えて反応を停止し、不溶物をセライトを用いて濾過した。減圧下で濾液を留去し、残渣に水と酢酸エチルを加え有機相を分離した後、水相を酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機相を水、飽和食塩水で順次洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去することにより 3-ヒドロキシメチル-2(1*H*)-ピリドン (7-008-01) (2.6 g, 59%) を白色固体として得た。

20 <sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 4.50 (s, 2H), 6.43 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 7.33-7.36 (m, 1H), 7.64-7.67 (m, 1H).

b) 1-ブチル-3-ヒドロキシメチル-2-ピリドン (7-008-02)の合成

3-ヒドロキシメチル-2(1*H*)-ピリドン (7-008-01) (0.63 g) の DMF (15 ml) 溶液

に、室温で炭酸カリウム (1.4 g)、および 1-ヨードブタン (1.86 g) を加えた。70 °C で 2 時間攪拌した後、溶媒を留去した。残渣に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加え有機相を分離した後、水相を酢酸エチルで 3 回抽出した。合わせた有機相を水、飽和食塩水で順次洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去し、得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィー (トルエン/アセトン = 2/1) で精製することにより 1-ブチル-3-ヒドロキシメチル-2-ピリドン (7-008-02) (0.56 g, 61%) を油状物質として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.96 (t, *J* = 7.3 Hz, 3H), 1.32-1.45 (m, 2H), 1.69-1.79 (m, 2H), 3.95 (t, *J* = 7.6 Hz, 2H), 4.57 (s, 2H), 6.20 (t, *J* = 6.7 Hz, 1H), 7.24 (dd, *J* = 6.7, 1.2 Hz, 1H), 7.28-7.31 (m, 1H).

c) 3-(ベンゾオキサゾール 2-イルオキシメチル)-1-ブチル-2-ピリドン (7-008-03) の合成

2-034-03 と同様にして合成した (50%)。

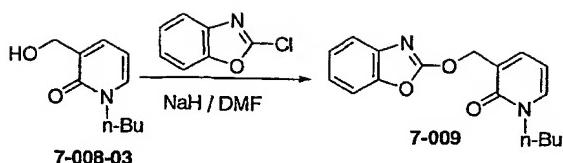
d) 1-ブチル-3-クロロメチル-2-ピリドン (7-008-04) の合成

1-ブチル-3-ヒドロキシメチル-2-ピリドン (7-008-03) (169 mg) の塩化メチレン (4.0 ml) 溶液に、室温で塩化チオニル (122 mg) を加えた。1 時間攪拌した後、溶媒を留去することにより 1-ブチル-3-クロロメチル-2-ピリドン (7-008-04) を油状物質として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.96 (t, *J* = 7.3 Hz, 3H), 1.32-1.45 (m, 2H), 1.69-1.79 (m, 2H), 3.96 (t, *J* = 7.3 Hz, 2H), 6.19 (t, *J* = 6.7 Hz, 1H), 7.27 (dd, *J* = 6.7, 2.1 Hz, 1H), 7.49 -7.53 (m, 1H).

e) 3-(ベンゾオキサゾール 2-イルスルファニルメチル)-1-ブチル-2-ピリドン (7-008) の合成

2-035 と同様にして合成した (97%)。

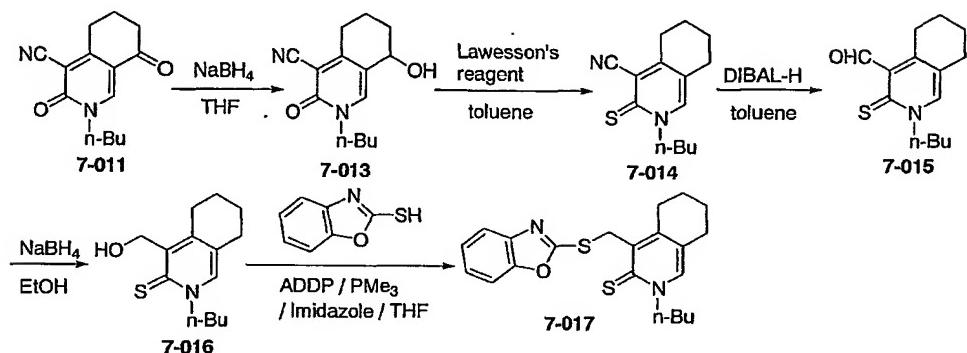


a) 3-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシメチル)-1-ブチル-2-ピリドン (7-009)の合成

2-035と同様にして合成した(50%)。

5

### ＜実施例 7-013～実施例 7-017＞



a) 2-ブチル-8-ヒドロキシ-3-オキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-013)の合成

10 2-ブチル-3,8-ジオキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-011) (10 mg, 0.04 mmol) を THF (1 ml) に溶解し、水素化ホウ素ナトリウム (2.1 mg, 0.056 mmol) を加え、室温で 10 分攪拌した。反応液に希塩酸 (1N, 3 ml) を加え酢酸エチル (10 ml) で抽出後、飽和食塩水 (5 ml) で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた結晶性残渣を塩化メチレンから再結晶し、  
15 2-ブチル-8-ヒドロキシ-3-オキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-013) (7.4 mg, 75%) を白色結晶として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.97 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H), 1.38 (sextet, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.76 (quint, *J* = 7.5 Hz, 2H), 2.15 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.61 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 3.06 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 3.45-3.58 (m, 1H), 4.03 (t, *J* = 7.5 Hz, 2H), 8.39 (s, 1H)

b) 2-ブチル-3-チオキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-014)の合成

2-ブチル-3-オキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-012) (80 mg, 0.35 mmol)をトルエン (8 ml)に溶解し、ローソン試薬 (169 mg, 0.42 mmol)を加え、12時間加熱還流した。室温まで冷却後、メタノール (14 ml)を加え1時間室温で攪拌し、反応液を減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、2-ブチル-3-チオキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-014) (63 mg, 73%)を淡褐色粉末として得た。

10  $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  0.98 (t,  $J = 7.5$  Hz, 3H), 1.41 (sextet,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 1.75-1.90 (m, 6H), 2.60 (t,  $J = 6.3$  Hz, 2H), 2.87 (t,  $J = 6.3$  Hz, 2H), 4.81 (t,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 7.50 (s, 1H).

c) 2-ブチル-3-チオキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボアルデヒド (7-015)の合成

15 2-ブチル-3-チオキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-014) (220 mg, 0.89 mmol)をトルエン (20 ml)に溶解し、氷冷下、水素化ジイソブチルアルミニウム (1M トルエン溶液, 1.7 ml, 1.7 mmol)を加え30分攪拌した。反応液に希塩酸 (1N, 5 ml)を加え酢酸エチル (10 ml)で抽出後、飽和食塩水 (10 ml)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮する。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、2-ブチル-3-チオキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボアルデヒド (7-015) (44 mg, 20%)を淡褐色結晶として得た。

10  $^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  0.99 (t,  $J = 7.5$  Hz, 3H), 1.44 (sextet,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 1.74 (quint,  $J = 3.3$  Hz, 4H), 1.87 (quint,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 2.62 (br t,  $J = 6.3$  Hz, 2H), 2.95 (br t,  $J = 6.3$  Hz, 2H), 4.51 (t,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 7.53 (s, 1H), 10.60 (s, 1H).

d) 2-ブチル-4-ヒドロキシメチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-2H-イソキノリン-3-チオ

ン (7-016)の合成

2-ブチル-3-チオキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボアルデヒド (7-015) (10 mg, 0.04 mmol)をメタノール (2 ml)に溶解し、水素化ホウ素ナトリウム (4.6 mg, 0.12 mmol)を加え室温で 10 分攪拌した。反応液に希塩酸 (1N, 4 ml)を加え酢酸エチル (10 ml)で抽出後、飽和食塩水 (5 ml)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(トルエン/酢酸エチル)にて精製し、2-ブチル-4-ヒドロキシメチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-2H-イソキノリン-3-チオン (7-016) (9 mg, 90%)を淡褐色粉末として得た。

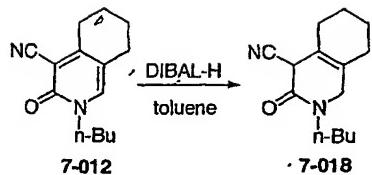
<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.99 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.43 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 1.71-1.95 (m, 6H), 2.66 (br t, J = 6.3 Hz, 2H), 2.83 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 4.58 (br t, J = 7.2 Hz, 2H), 4.79 (s, 2H), 7.61 (s, 1H).

e) 4-(ベンゾオキサゾール 2-イルチオメチル)-2-ブチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-2H-イソキノリン-3-チオン (7-017)の合成

2-ブチル-4-ヒドロキシメチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-2H-イソキノリン-3-チオン (7-016) (14 mg, 0.056 mmol)を THF (1 ml)に溶解し、2-メルカブトベンゾオキサゾール (16.3 mg, 0.11 mmol)、1,1'-(アゾジカルボニル)ジビペリジン (28.1 mg, 0.11 mmol)、イミダゾール (7.6 mg, 0.11 mmol)、トリメチルホスフィン (1M トルエン溶液, 0.11 ml, 0.11 mmol)をそれぞれ加え、室温で 18 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮しトルエン (2 ml)を加え析出してくる不溶物をろ過後、母液をシリカゲルクロマトグラフィー(トルエン/酢酸エチル)にて精製し、4-(ベンゾオキサゾール 2-イルチオメチル)-2-ブチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-2H-イソキノリン-3-チオン (7-017) (6.5 mg, 30%)を淡褐色粉末として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.70-1.95 (m, 6H), 2.62 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 3.01 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 4.58 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 5.05 (s, 2H), 7.15-7.30 (m, 2H), 7.42 (dd, J = 7.2 Hz, J = 1.8 Hz, 1H), 7.48 (br s, 1H), 7.60 (dd, J = 7.2 Hz, J = 1.8 Hz, 1H).

## &lt;実施例 7-018&gt;



a) 2-ブチル-3-オキソ-1,2,3,4,5,6,7,8-オクタヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル

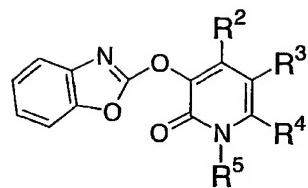
## 5 ル (7-018)の合成

2-ブチル-3-オキソ-2,3,5,6,7,8-ヘキサヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-012) (100 mg, 0.43 mmol)をトルエン (10 ml)に溶解し、氷冷下、水素化ジイソブチルアルミニウム (1M トルエン溶液, 0.8 ml, 0.8 mmol)を加え 10 分攪拌した。反応液に希塩酸 (1N, 5 ml)を加え酢酸エチル (10 ml)で抽出後、飽和食塩水 (5 ml)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、2-ブチル-3-オキソ-1,2,3,4,5,6,7,8-オクタヒドロ-イソキノリン-4-カルボニトリル (7-018) (70 mg, 70%)を白色粉末として得た。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 0.93 (t, *J*= 7.5 Hz, 3H), 1.32 (sextet, *J*= 7.5 Hz, 2H), 1.42-1.59 (m, 5H), 1.88 (s, 1H), 1.97-2.08 (m, 2H), 2.20-2.32 (m, 1H), 2.54-2.66 (m, 1H), 3.06-3.19 (m, 2H), 3.33-3.43 (m, 3H).

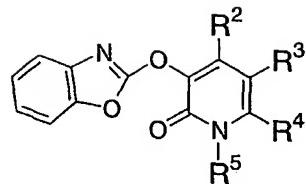
以下の表に、化合物の構造及びNMR値を記載する。

表 1



化合物 No.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
1-001	H	Me	Me	Me	2.16 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 3.62 (s, 3H), 7.17-7.26 (m, 2H), 7.34 (s, 1H), 7.34-7.43 (m, 1H), 7.46-7.50 (m, 1H).
1-002	H	Me	Me	Et	1.32 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 2.15 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 4.19 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 7.19-7.25 (m, 2H), 7.34 (s, 1H), 7.39-7.42 (m, 1H), 7.46-7.49 (m, 1H).
1-003	H	Me	Me	nPr	0.98 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.65-1.78 (m, 2H), 2.15 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 4.03-4.08 (m, 2H), 7.16-7.26 (m, 2H), 7.33 (s, 1H), 7.38-7.41 (m, 1H), 7.46-7.49 (m, 1H).
1-004	H	Me	Me	nBu	0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.48 (m, 2H), 1.62-1.72 (m, 2H), 2.15 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 4.10 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 7.19-7.25 (m, 2H), 7.33 (s, 1H), 7.38-7.42 (m, 1H), 7.46-7.49 (m, 1H).
1-005	H	Me	Me	Bn	2.14 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 5.42 (br s, 2H), 7.17-7.51 (m, 10H).
1-006	H		H	nBu	0.94 (t, J = 7.4 Hz, 3H), 1.35-1.48 (m, 2H), 1.76-1.86 (m, 2H), 4.06 (t, J = 7.4 Hz, 2H), 7.22-7.28 (m, 3H), 7.34-7.51 (m, 7H), 7.81 (d, J = 2.5 Hz, 1H).
1-007	H		H	nBu	0.96 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.35-1.48 (m, 2H), 1.75-1.85 (m, 2H), 4.05 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 7.10-7.17 (m, 2H), 7.22-7.24 (m, 3H), 7.37-7.44 (m, 3H), 7.48-7.52 (m, 1H), 7.76 (d, J = 2.7 Hz, 1H).
1-008	H		H	nBu	0.97 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.36-1.49 (m, 2H), 1.79-1.87 (m, 2H), 4.08 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 7.23-7.27 (m, 2H), 7.37-7.44 (m, 2H), 7.45-7.52 (m, 1H), 7.50 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.75-7.78 (m, 1H), 7.81 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.74 (s, 1H).

表 2

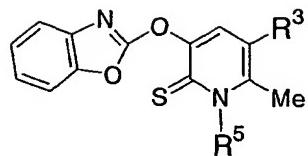


化合物 No.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
1-009	H		H	nBu	0.97 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 1.38-1.48 (m, 2H), 1.75-1.85 (m, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 2H), 6.92 (s, 1H), 7.23-7.52 (m, 6H), 7.67-7.69 (m, 2H), 7.71 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 7.89 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H).
1-010	Me	H	Me	nBu	0.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.39 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.71 (m, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 3.99 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 5.95 (s, 1H), 7.18 (ddd, <i>J</i> = 7.5, 7.5, 1.8 Hz), 7.23 (ddd, <i>J</i> = 7.5, 7.5, 1.8 Hz, 1H), 7.40 (m, 1H), 7.47 (m, 1H).
1-011		H	Me	nBu	0.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.68-1.78 (m, 2H), 1.73 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 3H), 3.32 (s, 2H), 3.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.82 (s, 1H), 4.88 (s, 1H), 6.13 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.17 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.19 (ddd, <i>J</i> = 7.5, 7.5, 1.5 Hz, 1H), 7.23 (ddd, <i>J</i> = 7.5, 7.5, 1.5 Hz, 1H), 7.40 (m, 1H), 7.48 (m, 1H).

表 3

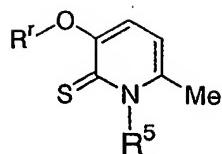
化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
1-012		2.16 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 7.20-7.29 (m, 2H), 7.40-7.44 (m, 1H), 7.58-7.61 (m, 1H), 7.83 (s, 1H).
1-013		0.95 (t, J = 7.2 Hz), 1.35-1.48 (m, 2H), 1.60-1.72 (m, 2H), 2.15 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 4.11 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 7.22-7.29 (m, 2H), 7.41-7.44 (m, 1H), 7.57-7.61 (m, 1H), 7.81 (s, 1H).
1-014		0.96 (t, J = 7.2 Hz, 6H), 1.30-1.60 (m, 4H), 1.60-1.75 (m, 2H), 1.76-1.90 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 3.89 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 4.02 (t, J = 8.1 Hz, 2H), 5.88 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 6.52 (d, J = 7.2 Hz, 1H).
1-015		0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.40 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, J = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 1.87 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 2.58 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.69 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.02 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 7.16-7.26 (m, 2H), 7.24 (s, 1H), 7.40 (dd, J = 6.9 Hz, 2.4 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 6.9 Hz, 2.4 Hz, 1H).
1-016		0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.42 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.76 (m, 4H), 1.81 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 2.43 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.61 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.01 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 5.07 (s, 2H), 6.43 (s, 1H), 7.28-7.39 (m, 1H), 7.34 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.45 (d, J = 7.5 Hz, 2H).
1-017		3.23 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 4.24 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 6.10 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 1.8, 6.9 Hz, 1H), 7.08-7.29 (m, 5H), 7.42-7.45 (m, 1H), 7.49-7.52 (m, 2H), 7.56 (dd, J = 1.2, 7.8 Hz, 1H).
1-018		3.03 (t, J = 6.1 Hz, 2H), 4.34 (t, J = 6.1 Hz, 2H), 6.74 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.19-7.45 (m, 6H), 7.50 (d, J = 6.4 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.73 (d, J = 7.3 Hz, 1H).
1-019		0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.41 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.58-1.73 (m, 4H), 1.81 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 2.45 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.61 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.18 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 4.00 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 4.07 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 6.34 (s, 1H), 7.21-7.33 (m, 5H).

表 4



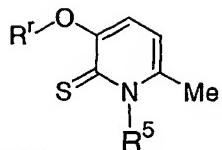
化合物 No.	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
2-001	Me	Me	2.28 (s, 3H), 2.49 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.40 (s, 1H), 7.43-7.49 (m, 2H).
2-002	Me	Et	1.46 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.55 (s, 3H), 4.92 (br s, 2H), 7.18-7.24 (m, 2H), 7.37 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-003	Me	nPr	1.04 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.89 (br s, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.52 (s, 3H), 4.71 (br s, 2H), 7.19-7.26 (m, 2H), 7.36 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-004	Me	nBu	0.99 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.42-1.54 (m, 2H), 1.83 (br s, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.53 (s, 3H), 4.80 (br s, 2H), 7.18-7.26 (m, 2H), 7.36 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-005	Me	iBu	0.97-0.99 (m, 6H), 2.27 (s, 3H), 2.51 (s, 3H), 2.51-2.66 (m, 1H), 3.81 (br s, 1H), 5.64 (br s, 1H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.39 (s, 1H), 7.42-7.48 (m, 2H).
2-006	Me	nPent	0.92 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.48 (m, 4H), 1.85 (br s, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.53 (s, 3H), 4.76 (br s, 2H), 7.18-7.26 (m, 2H), 7.36 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-007	Me	nHexyl	0.89 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.30-1.50 (m, 6H), 1.84 (br s, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.52 (s, 3H), 4.79 (br s, 2H), 7.17-7.26 (m, 2H), 7.35 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-008	Me	Bn	2.24 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 6.27 (br s, 2H), 7.14-7.52 (m, 10H).
2-009	Et	Me	1.23 (t, J = 7.8 Hz, 3H), 2.50 (s, 3H), 2.61 (q, J = 7.8 Hz, 2H), 4.17 (s, 3H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.42 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-010	Et	Et	1.23 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.47 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 2.57 (s, 3H), 2.59 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 4.92 (br s, 2H), 7.18-7.24 (m, 2H), 7.39 (s, 1H), 7.43-7.49 (m, 2H).
2-011	Et	nPr	1.04 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.22 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.89 (br s, 2H), 2.54 (s, 3H), 2.59 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 4.72 (br s, 2H), 7.18-7.24 (m, 2H), 7.38 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-012	Et	nBu	0.99 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.22 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.42-1.54 (m, 2H), 1.83 (br s, 2H), 2.55 (s, 3H), 2.59 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 4.77 (br s, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.38 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-013	Et	Bn	1.22 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.57 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 6.26 (br s, 2H), 7.13-7.51 (m, 10H).

表 5



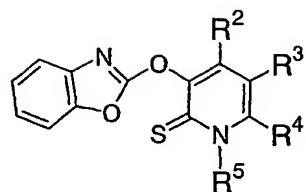
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
2-014		Me	2.55 (s, 3H), 4.10 (s, 3H), 6.57 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.20-7.26 (m, 2H), 7.40-7.50 (m, 3H).
2-015		nBu	0.99 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.47 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.84 (m, 2H), 2.58 (s, 3H), 4.69 (br s, 2H), 6.52 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.20-7.26 (m, 2H), 7.30-7.50 (m, 3H).
2-016		nBu	0.82 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.32 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.47-1.52 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 4.37 (br s, 2H), 4.80 (s, 2H), 7.06 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.26-7.35 (m, 3H), 7.38-7.44 (m, 1H), 7.60-7.67 (m, 1H).
2-017	Ac	nBu	0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.47 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.83 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.54 (s, 3H), 4.70 (br s, 2H), 6.44 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 7.5 Hz, 1H).
2-018	H	nBu	1.02 (t, J = 7.8 Hz, 3H), 1.50 (sextet, J = 7.8 Hz, 2H), 1.80-1.90 (m, 2H), 2.51 (s, 3H), 4.66 (br s, 2H), 6.49 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 6.91 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.44 (br s, 1H).
2-019		nBu	0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.41 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.70 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.52 (s, 3H), 4.61 (brs, 2H), 6.38 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.26-7.35 (m, 3H), 7.97 (d, J = 8.7 Hz, 1H).
2-020	H <sub>3</sub> C-SO <sub>2</sub> <sup>-</sup>	nBu	1.01 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.49 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 1.82 (m, 2H), 2.57 (s, 3H), 3.48 (dd, J = 3.0, 1.5 Hz, 3H), 4.70 (brs, 2H), 6.47 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.31 (dd, J = 7.8, 1.8 Hz, 1H).
2-021		nBu	0.98 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.46 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.81 (m, 2H), 2.51 (s, 3H), 4.00 (s, 2H), 4.67 (brs, 2H), 6.39 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 6.98 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.10-7.50 (m, 5H).
2-022		nBu	0.99 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.47 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 1.85 (m, 2H), 2.54 (s, 3H), 2.90-3.00 (m, 2H), 3.10-3.20 (m, 2H), 4.70 (brs, 2H), 3.10-3.20 (m, 2H), 4.70 (brs, 2H), 6.42 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 6.97 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.18-7.34 (m, 5H).

表 6



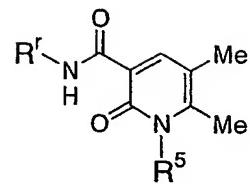
化合物 No.	R' 基团	R <sup>5</sup> 基团	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
2-023		nBu	0.92 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.37 (m, 4H), 2.41 (s, 3H), 4.17 (brs, 2H), 4.47 (s, 2H), 6.99 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H), 7.00-7.30 (m, 5H).
2-024		nBu	0.94 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.40 (sextet, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 1.70 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.89 (s, 6H), 4.60 (br s, 2H), 6.27 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.97 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.2 Hz, 1H), 7.21 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.51 (dd, <i>J</i> = 8.1, 7.8 Hz, 1H), 7.61 (dd, <i>J</i> = 8.4, 7.8 Hz, 1H), 8.28 (dd, <i>J</i> = 7.2, 0.9 Hz, 1H), 8.61 (t, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H).
2-025		nBu	1.02 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.50 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.80-1.85 (m, 2H), 2.51 (s, 3H), 4.67 (br s, 2H), 6.51 (dd, <i>J</i> = 5.1, 4.8 Hz, 1H), 6.57 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.38 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.70-7.85 (m, 2H).
2-026	nBu	nBu	0.90-1.03 (m, 6H), 1.4-1.6 (m, 4H), 1.8-1.9 (m, 4H), 2.50 (s, 3H), 3.98 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 4.76 (brs, 2H), 6.40 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.60 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
2-027		nBu	0.91 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.25-1.44 (m, 4H), 1.25-1.44 (m, 4H), 2.40 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.18 (brs, 2H), 4.44 (s, 2H), 6.73 (A <sub>2</sub> B <sub>2</sub> -type, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 6.98 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.09 (A <sub>2</sub> B <sub>2</sub> -type, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 7.25 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H).
2-028	EtO <sub>2</sub> C-	nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.84 (m, 2H), 2.55 (s, 3H), 4.35 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.69 (brs, 2H), 6.45 (dd, <i>J</i> = 7.5, 0.6 Hz, 1H), 7.12 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
2-029		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.48 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.85 (m, 2H), 2.57 (s, 3H), 4.73 (brs, 2H), 6.48 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.18 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.20-7.70 (m, 3H), 8.20-8.30 (m, 2H).

表 7



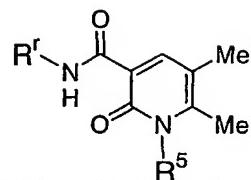
化合物 No.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
2-030	H	H	H	iPr	1.45 (s, 3H), 1.48 (s, 3H), 6.31-6.45 (m, 1H), 6.76 (t, J = 7.0 Hz, 1H), 7.03-7.29 (m, 3H), 7.43-7.29 (m, 3H), 7.43-7.54 (m, 2H), 7.74 (dd, J = 1.5, 7.0 Hz, 1H).
2-031	Me	H	H	nPr	1.00 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.83-2.02 (m, 2H), 4.48 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 6.56 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 7.20-7.28 (m, 2H), 7.43-7.49 (m, 2H), 7.57 (d, J = 6.6 Hz, 1H).
2-032	-CH <sub>2</sub> OMe	H	H	nPr	0.96 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.35-1.47 (m, 2H), 1.81-1.91 (m, 2H), 3.43 (s, 3H), 4.48-4.56 (m, 3H), 6.89 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 6.97-7.48 (m, 4H), 7.68 (d, J = 6.7 Hz, 1H).
2-033	H	H	H	nBu	0.98 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.83-1.94 (m, 2H), 4.57 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 6.65-6.70 (m, 1H), 7.22-7.27 (m, 2H), 7.43-7.51 (m, 3H), 7.68 (dd, J = 1.5, 6.4 Hz, 1H).
2-034	Me	H	H	nBu	0.95 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.46 (m, 2H), 1.79-1.90 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 4.51 (t, J = 7.4 Hz, 2H), 6.55 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 7.20-7.28 (m, 2H), 7.43-7.48 (m, 2H), 7.59 (d, J = 6.6 Hz, 1H).
2-035	H	Me	H	nBu	0.97 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.36-1.46 (m, 2H), 1.82-1.92 (m, 2H), 4.54 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 7.19-7.27 (m, 2H), 7.40-7.52 (m, 4H).
2-036	H	Br	H	nBu	0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.83-1.93 (m, 2H), 4.53 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.21-7.30 (m, 2H), 7.42-7.52 (m, 2H), 7.64 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 2.1 Hz, 1H).
2-037	H		H	nBu	1.00 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.45 (sextet, J = 7.3 Hz, 2H), 1.85-1.97 (m, 2H), 4.57 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 7.22-7.28 (m, 2H), 7.34-7.44 (m, 3H), 7.44-7.52 (m, 4H), 7.61 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 1.8 Hz, 1H).

表 8



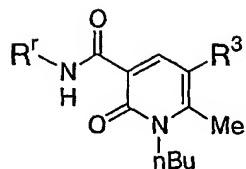
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
3-001		Me	2.20 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.62 (s, 3H), 4.65 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 7.21-7.38 (m, 5H), 8.37 (s, 1H), 10.28 (br s, 1H).
3-002		Me	2.19 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.93 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 3.62 (s, 3H), 3.65-3.72 (m, 2H), 7.21-7.33 (m, 5H), 8.34 (s, 1H), 9.99 (br s, 1H).
3-003		Et	1.32 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 4.20 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 4.64 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.38 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
3-004		Et	1.33 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.93 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.64-3.71 (m, 2H), 4.21 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 7.18-7.33 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).
3-005		nPr	1.03 (t, J = 7.8 Hz, 3H), 1.65-1.78 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 4.07 (t, J = 8.1 Hz, 2H), 4.65 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.38 (m, 5H), 8.36 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
3-006		nPr	1.05 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.67-1.80 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.92-2.97 (m, 2H), 3.64-3.72 (m, 2H), 4.09 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 7.20-7.35 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.05 (br s, 1H).
3-007		iPr	1.60 (s, 3H), 1.63 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 4.64 (d, J = 6.0 Hz, 3H), 7.24-7.34 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.31 (br s, 1H).
3-008		iPr	1.62 (s, 3H), 1.64 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.93 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 3.62-3.69 (m, 2H), 4.64 (br s, 1H), 7.18-7.33 (m, 5H), 8.28 (s, 1H), 10.04 (br s, 1H).
3-009		nBu	0.98 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.51 (m, 2H), 1.61-1.71 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 4.10 (t, J = 8.1 Hz, 2H), 4.64 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 7.21-7.38 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
3-010		nBu	1.00 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.40 (m, 2H), 1.61-1.72 (m, 2H), 2.93 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.11 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 7.18-7.32 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).

表 9



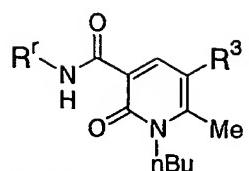
化合物 No.	R' 	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
3-011		nHexyl	0.89 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30-1.50 (m, 6H), 1.60-1.75 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 7.23-7.38 (m, 5H), 8.35 (s, 1H).
3-012		nHexyl	0.91 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.32-1.45 (m, 6H), 1.63-1.70 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.18-7.32 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.04 (br s, 1H).
3-013		Bn	2.19 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 5.44 (br s, 2H), 7.07-7.38 (m, 10H), 8.44 (s, 1H), 10.24 (br s, 1H).
3-014		Bn	2.18 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.64-3.71 (m, 2H), 5.45 (br s, 2H), 7.08-7.36 (m, 10H), 8.41 (s, 1H), 9.98 (br s, 1H).
3-015		Ph	2.00 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 4.58 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 7.15-7.32 (m, 7H), 7.49-7.58 (m, 3H), 8.49 (s, 1H), 10.02 (br s, 1H).
3-016		Ph	2.00 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.88 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.59-3.66 (m, 2H), 7.16-7.29 (m, 7H), 7.51-7.61 (m, 3H), 8.46 (s, 1H), 9.82 (br s, 1H).

表 10



化合物 No.	R'	R <sup>3</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
3-033		nBu	0.93 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32-1.51 (m, 6H), 1.61-1.69 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.48 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.23-7.38 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
3-034		nBu	0.93 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30-1.54 (m, 6H), 1.63-1.72 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.48 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 2.93 (m, 2H), 3.62-3.70 (m, 2H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.16-7.32 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.04 (br s, 1H).
3-035		nPentyl	0.90 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30-1.53 (m, 8H), 1.62-1.69 (m, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.48 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 7.23-7.38 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.31 (br s, 1H).
3-036		nPentyl	0.90 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.28-1.39 (m, 4H), 1.40-1.55 (m, 4H), 1.62-1.72 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.47 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.20-7.32 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.04 (br s, 1H).
3-037		I	0.98 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.61-1.71 (m, 2H), 2.71 (s, 3H), 4.16 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 4.63 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.22-7.37 (m, 5H), 8.78 (s, 1H), 10.4 (br s, 1H).
3-038		I	1.00 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.39-1.51 (m, 2H), 1.59 (s, 3H), 1.61-1.71 (m, 2H), 2.71 (s, 3H), 2.92 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 3.62-3.69 (m, 2H), 4.17 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 7.19-7.33 (m, 5H), 8.74 (s, 1H), 9.77 (br s, 1H).
3-039			1.00 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.41-1.53 (m, 2H), 1.68-1.78 (m, 2H), 4.15 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.22-7.45 (m, 10H), 8.46 (s, 1H), 10.25 (br s, 1H).
3-040			1.02 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.43-1.55 (m, 2H), 1.69-1.79 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 3.65-3.72 (m, 2H), 4.16 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 7.19-7.45 (m, 10H), 8.43 (s, 1H), 9.98 (br s, 1H).

表 1 1



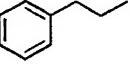
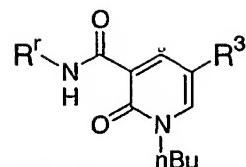
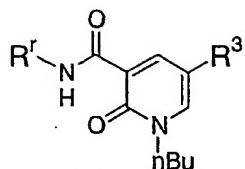
化合物 No.	R'	R <sup>3</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
3-044		CF <sub>3</sub>	1.02 (t, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 1.42-1.54 (m, 2H), 1.66-1.74 (m, 2H), 2.61 (s, 3H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 3.64-3.69 (m, 2H), 4.14 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 7.20-7.33 (m, 5H), 8.69 (s, 1H), 9.61 (brs, 1H).

表 1 2



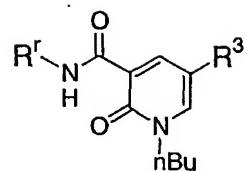
化合物 No.	R' No.	R <sup>3</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
3-061	n-Hexyl		0.86-0.91 (m, 6H), 0.95 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.26-1.47 (m, 16H), 1.54-1.65 (m, 4H), 1.73-1.83 (m, 2H), 3.38-3.45 (m, 4H), 4.07 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 6.72 (t, J = 5.5 Hz, 1H), 8.40 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.83 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 9.69 (t, J = 5.5 Hz, 1H).
3-062			1.02 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.33-1.45 (m, 2H), 1.72-1.82 (m, 2H), 4.06 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 4.58 (d, J = 5.5 Hz, 4H), 6.81 (br s, 1H), 7.24-7.36 (m, 10H), 7.42 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.78 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 10.00 (br s, 1H).
3-063			0.97 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.33-1.46 (m, 2H), 1.72-1.82 (m, 2H), 2.88-2.94 (m, 4H), 3.63-3.72 (m, 4H), 4.06 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 7.20-7.34 (m, 10H), 8.37 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.65 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 9.52 (br s, 1H).
3-064			0.91-0.96 (m, 6H), 0.93 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.32-1.44 (m, 4H), 1.54-1.65 (m, 6H), 1.71-1.81 (m, 2H), 3.38 (br s, 4H), 4.02 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 4.64 (d, J = 5.8 Hz, 2H), 7.23-7.39 (m, 5H), 7.85 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.58 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 10.04 (t, J = 5.5 Hz, 1H).
3-065			0.96 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.15-1.49 (m, 6H), 1.64-1.81 (m, 6H), 1.96-2.05 (m, 2H), 3.87-3.99 (m, 1H), 4.05 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 4.64 (d, J = 5.8 Hz, 2H), 6.10 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 6.92-7.38 (m, 5H), 8.38 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.72 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 10.05 (t, J = 5.8 Hz, 1H).
3-066			0.89 (t, J = 6.7 Hz, 3H), 0.97 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.27-1.45 (m, 8H), 1.54-1.63 (m, 2H), 1.73-1.82 (m, 2H), 2.93 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 3.38-3.45 (m, 2H), 3.65-3.72 (m, 2H), 4.06 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 6.44 (t, J = 5.5 Hz, 1H), 7.20-7.34 (m, 5H), 8.39 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 9.78 (t, J = 5.5 Hz, 1H).

表 1 3



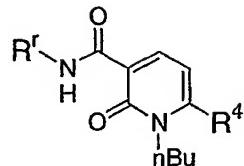
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>s</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
3-067		I	0.96 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.31-1.44 (m, 2H), 1.68-1.78 (m, 2H), 3.95 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 4.62 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 7.23-7.36 (m, 5H), 7.70 (d, <i>J</i> = 2.6 Hz, 1H), 8.67 (d, <i>J</i> = 2.6 Hz, 1H), 10.03 (br s, 1H).
3-068			0.98 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.36-1.48 (m, 2H), 1.75-1.85 (m, 2H), 4.08 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 4.67 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.22-7.50 (m, 10H), 7.69 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.87 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 10.25 (br s, 1H).
3-069			0.98 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 3H), 1.34-1.46 (m, 2H), 1.72-1.82 (m, 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.23-7.40 (m, 8H), 7.45-7.51 (m, 2H), 7.73 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.66 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 10.03 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H).
3-070	nBuO	H	0.95 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38 (sextet, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 1.73-1.79 (m, 2H), 3.90 (s, 3H), 3.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.24 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 7.53 (dd, <i>J</i> = 6.7, 2.1 Hz, 1H), 8.14 (dd, <i>J</i> = 7.5, 2.4 Hz, 1H).
3-071		H	0.95 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.36 (sextet, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 1.66-1.80 (m, 2H), 3.96 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.60 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 6.36 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H), 7.46 (dd, <i>J</i> = 6.3, 2.1 Hz, 1H), 8.47 (dd, <i>J</i> = 7.2, 2.4 Hz, 1H).
3-072		CF <sub>3</sub>	0.99 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.47 (m, 2H), 1.72-1.82 (m, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 3.66-3.73 (m, 2H), 7.20-7.34 (m, 5H), 7.83 (m, 1H), 8.69 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 9.62 (br s, 1H).
3-073			0.99 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 2.95 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 3.66-3.73 (m, 2H), 4.07 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 7.19-7.31 (m, 6H), 7.84 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H), 7.65 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.63 (dd, <i>J</i> = 2.7, 0.6 Hz, 1H), 9.89 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H).

表 1 4



化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>3</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
3-074			1.00 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.70-1.87 (m, 2H), 2.97 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 3.69-3.76 (m, 2H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 6.58 (brs, 1H), 7.20-7.34 (m, 6H), 7.44-7.47 (m, 2H), 8.63 (s, 1H), 8.89 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 10.11 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H).

表 15



化合物 No.	R <sup>x</sup>	R <sup>4</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
3-081		Me	0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 4.05 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 4.27 (dd, <i>J</i> = 7.2, 6.6 Hz, 1H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 7.20-7.40 (m, 5H), 8.41 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 10.2 (br s, 1H).
3-082		nPentyl	0.93 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.50 (m, 6H), 1.62-1.70 (m, 4H), 2.67 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 6.27 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H), 8.44 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 10.21 (br s, 1H).
3-083		nPentyl	0.93 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.49 (m, 6H), 1.63-1.70 (m, 4H), 2.66 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.63-3.68 (m, 2H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.27 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.17-7.32 (m, 5H), 8.40 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 9.94 (br s, 1H).
3-084		nHexyl	0.91 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30-1.50 (m, 8H), 1.60-1.72 (m, 4H), 2.67 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 6.28 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H), 8.44 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 10.21 (br s, 1H).
3-085		nHexyl	0.91 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.31-1.49 (m, 8H), 1.61-1.71 (m, 4H), 2.67 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.27 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.18-7.33 (m, 5H), 8.41 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 9.94 (t, <i>J</i> = 5.1 Hz, 1H).

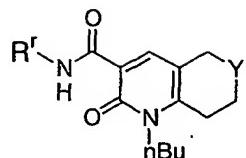
表 1 6

化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
3-101		3.03 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.35 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.68 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 6.94 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.23-7.49 (m, 8H), 7.81 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 8.63 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 10.22 (br s, 1H).
3-102		1.79-1.88 (m, 2H), 1.95-2.03 (m, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.04 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 6.26 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 7.20-7.38 (m, 5H), 8.46 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 10.19 (br s, 1H).
3-103		2.97 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 3.04 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 3.68-3.75 (m, 2H), 4.35 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 6.92 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.19-7.35 (m, 5H), 7.37-7.43 (m, 3H), 7.80 (dd, <i>J</i> = 1.5, 7.3 Hz, 1H), 8.59 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 9.93 (br s, 1H).
3-104		1.79-1.88 (m, 2H), 1.95-2.04 (m, 2H), 2.87 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 3.65-3.72 (m, 2H), 4.04 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 6.24 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 7.18-7.33 (m, 5H), 8.42 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 9.90 (br s, 1H).
3-105		0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.42 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.63 (s, 3H), 3.91 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 4.60 (s, 2H), 6.05 (s, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H).
3-106		0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.72 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.61 (s, 3H), 2.93 (t-like, 2H), 3.63 (t-like, 2H), 4.00 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 6.04 (s, 1H), 7.17-7.33 (m, 5H).
3-107		0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.42 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.58-1.72 (m, 2H), 2.08 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.52 (s, 3H), 4.08 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.62 (s, 2H), 7.20-7.42 (m, 5H), 9.02 (br s, 1H).
3-108		0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.58-1.72 (m, 2H), 2.07 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.67 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.07 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.16-7.34 (m, 5H), 8.47 (br s, 1H).

表 17

化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
3-109		1.00-1.28 (m, 4H), 1.56-1.90 (m, 7H), 2.18 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 4.00 (br s, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.20-7.40 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.3 (br s, 1H).
3-110		1.00-1.30 (m, 4H), 1.58-1.90 (m, 7H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.62-3.69 (m, 2H), 4.01 (br s, 2H), 7.18-7.35 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.3 (br s, 1H).
3-111		0.92 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.42 (m, 4H), 1.60-1.75 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 4.08 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 7.20-7.40 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.3 (br s, 1H).
3-112		0.94 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.42 (m, 4H), 1.60-1.75 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.60-3.70 (m, 2H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.20-7.35 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).

表 1 8



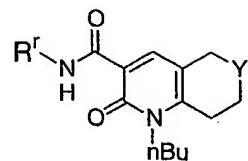
化合物 No.	R <sup>r</sup>	Y	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
4-001		-CH <sub>2</sub> -	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.62 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.23-7.38 (m, 5H), 8.28 (s, 1H), 10.32 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-002		-CH <sub>2</sub> -	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.66 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.20-7.33 (m, 5H), 8.25 (s, 1H), 10.05 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-003		-CH <sub>2</sub> -	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.73 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.87 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.73 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.82 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.60 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.65 (dd, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2.1 Hz, 2H), 7.05 (dd, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2.1 Hz, 2H), 8.23 (s, 1H), 10.01 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-004		-CH <sub>2</sub> -	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.65 (quint, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.74 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.70 (q, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.20 (d, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 8.22 (s, 1H), 8.51 (br s, 2H), 10.10 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-005		-CH <sub>2</sub> -	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.70 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.76 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.91 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.78 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.09 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.34 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.77 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.34 (s, 1H), 12.18 (br s, 1H).

表 19



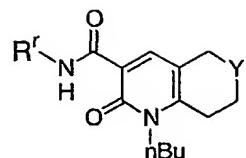
化合物 No.	R <sup>r</sup>		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
4-006		-CH <sub>2</sub> -	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.65 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.02 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.53 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 5.02 (s, 2H), 6.74 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 6.81 (dd, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1.8 Hz, 1H), 6.86 (d, <i>J</i> = 1.8 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 10.26 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-007		-CH <sub>2</sub> -	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.73 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.62 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 6.25 (dd, <i>J</i> = 3.0 Hz, 0.9 Hz, 1H), 6.28-6.31 (m, 1H), 7.35 (d, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 10.25 (br t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H).

表 20



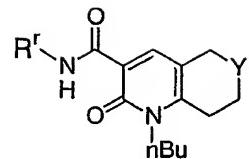
化合物 No.	R'		<sup>1</sup> H-NMR ( $\text{CDCl}_3$ )
4-008		-CH <sub>2</sub> -	0.98 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.43 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.62 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.74 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 1.88 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.62 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.74 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.03 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.59 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 7.26 (s, 2H), 7.28 (s, 2H), 8.26 (s, 1H), 10.35 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).
4-009		-CH <sub>2</sub> -	0.97 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.43 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.64 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.74 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 1.88 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.62 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.73 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.78 (s, 3H), 4.01 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.57 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 6.85 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.29 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 8.27 (s, 1H), 10.24 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).
4-010		-O-	0.98 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.43 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.66 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.82 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.01 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.02 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.60 (s, 2H), 4.64 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 7.24-7.38 (m, 5H), 8.22 (s, 1H), 10.22 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).
4-011		-O-	1.00 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.45 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.69 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.83 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.98 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 3.67 (dt, $J = 9.0$ Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.01 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.03 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.60 (s, 2H), 7.18-7.36 (m, 5H), 8.19 (s, 1H), 9.96 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).
4-012		-O-	0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.45 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.67 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.82 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.83 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 3.61 (dt, $J = 9.0$ Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.01 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.03 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.59 (s, 2H), 6.71 (d, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.07 (d, $J = 7.5$ Hz, 2H), 8.17 (s, 1H), 9.92 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).

表 2 1



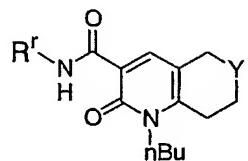
化合物 No.	R <sup>x</sup>		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
4-013			0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.41 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.73 (m, 2H), 2.78 (d, <i>J</i> = 4.2 Hz, 2H), 2.84 (d, <i>J</i> = 4.2 Hz, 2H), 3.48 (s, 2H), 3.69 (s, 2H), 3.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.63 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.26-7.37 (m, 10H), 8.21 (s, 1H), 10.24 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-014			0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.65 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.78 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 2.85 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.48 (s, 2H), 3.66 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 3.69 (s, 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.23-7.38 (m, 10H), 8.18 (s, 1H), 9.99 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 2 2



化合物 No.	R <sup>r</sup>		<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
4-015			0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.65 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.77 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.19 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.86 (s, 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.23-7.38 (m, 5H), 8.24 (s, 1H), 10.27 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-016			0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.78 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.19 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.67 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 3.86 (s, 2H), 4.02 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.18-7.34 (m, 5H), 8.21 (s, 1H), 10.01 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-017			0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.93 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.80 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.02 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.49 (s, 2H), 4.62 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.23-7.35 (m, 5H), 7.43-7.51 (m, 5H), 8.10 (s, 1H), 10.16 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-018			0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.55-1.90 (m, 10H), 2.84 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 2.91 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.82 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1/3×2H), 3.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2/3×2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.52 (s, 2/3×2H), 4.59 (s, 1/3×2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.39 (m, 5H), 8.31 (s, 2/3×1H), 8.33 (s, 1/3×1H), 10.20 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 2 3



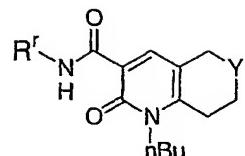
化合物 No.	R <sup>r</sup>	Y	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
4-019			0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.67 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.37 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.84 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2/3 × 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1/3 × 2H), 3.77 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1/3 × 2H), 3.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2/3 × 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.47 (s, 2/3 × 2H), 4.58 (s, 1/3 × 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.39 (m, 5H), 8.30 (s, 2/3 × 1H), 8.33 (s, 1/3 × 1H), 10.19 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-020			0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.29 (s, 9H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.65 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.85 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.00 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.62 (s, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.38 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.20 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 2 4



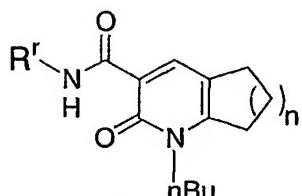
化合物 No.	R <sup>r</sup>	Y	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
4-021			0.88 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1/3 × 3H), 0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2/3 × 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.86 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1/3 × 2H), 2.99 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2/3 × 2H), 3.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1/3 × 2H), 4.02 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2/3 × 2H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.40 (s, 1/3 × 2H), 4.62 (s, 2/3 × 2H), 4.63 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.38 (m, 7H), 8.11 (s, 2/3 × 1H), 8.39 (s, 1/3 × 1H), 8.76 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 10.12 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-022			1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.67 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.66 (dt, <i>J</i> = 6.3 Hz, 6.9 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.04 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.48 (br s, 2/3 × 2H), 4.68 (br s, 1/3 × 2H), 7.20-7.32 (m, 5H), 7.44-7.51 (m, 5H), 8.08 (br s, 2/3 × 1H), 8.37 (br s, 1/3 × 1H), 9.89 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-023			0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.88 (m, 10H), 2.83 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.68 (dt, <i>J</i> = 6.6 Hz, 7.2 Hz, 2H), 3.82 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1/3 × 2H), 3.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2/3 × 2H), 4.02 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.52 (s, 2/3 × 2H), 4.58 (s, 1/3 × 2H), 7.18-7.34 (m, 5H), 8.27 (s, 2/3 × 1H), 8.30 (s, 1/3 × 1H), 9.93 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 25



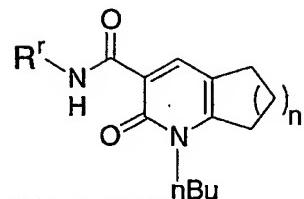
化合物 No.	$\text{R}^r$	$\text{Y}$	$^1\text{H-NMR (CDCl}_3)$
4-024			0.98 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.45 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.66 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.67 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.37 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.84 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.93 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 3.68 (q, $J = 6.9$ Hz, 2H), 3.77 (t, $J = 6.0$ Hz, 1/3 × 2H), 3.90 (t, $J = 6.0$ Hz, 2/3 × 2H), 4.03 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.47 (s, 2/3 × 2H), 4.58 (s, 1/3 × 2H), 7.20-7.33 (m, 5H), 8.27 (s, 2/3 × 1H), 8.30 (s, 1/3 × 1H), 9.81 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1/3 × 1H), 9.93 (br t, $J = 6.0$ Hz, 2/3 × 1H).
4-025			1.00 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.30 (s, 9H), 1.45 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.66 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.85 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.93 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 3.68 (dt, $J = 9.0$ Hz, 6.0 Hz, 2H), 3.90 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.01 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.62 (s, 2H), 7.18-7.33 (m, 5H), 8.28 (s, 1H), 9.94 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).
4-026			0.88 (t, $J = 7.5$ Hz, 1/3 × 3H), 1.00 (t, $J = 7.5$ Hz, 2/3 × 3H), 1.46 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.65 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.82-3.01 (m, 4H), 3.66 (dt, $J = 9.0$ Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.04 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.07 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.39 (br s, 2/3 × 2H), 4.73 (br s, 1/3 × 2H), 7.20-7.37 (m, 7H), 8.07 (s, 2/3 × 1H), 8.35 (s, 1/3 × 1H), 8.76 (d, $J = 4.8$ Hz, 2H), 9.85 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).

表 2 6



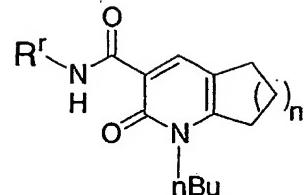
化合物 No.	R <sup>r</sup>	n	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
4-051		1	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.41 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.19 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.85 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.98 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.23-7.39 (m, 5H), 8.46 (s, 1H), 10.31 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-052		1	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.41 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.70 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.19 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.85 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.67 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 3.99 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.18-7.34 (m, 5H), 8.43 (s, 1H), 10.05 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-053		3	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.57-1.65 (m, 4H), 1.68 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.86 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.22-7.38 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.31 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-054		3	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.67 (m, 4H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.86 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.72 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.66 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.17 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.19-7.34 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.05 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-055		3	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.58-1.65 (m, 4H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.86 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.59 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 6.99 (t, <i>J</i> = 9.0 Hz, 2H), 7.32 (dd, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 8.32 (s, 1H), 10.32 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-056		3	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.57-1.66 (m, 4H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.86 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.63 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.97 (t, <i>J</i> = 9.0 Hz, 2H), 7.20 (dd, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 8.29 (s, 1H), 10.04 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 2 7



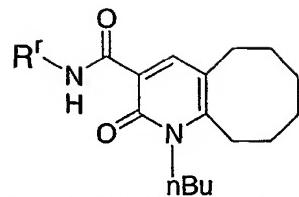
化合物 No.	R <sup>r</sup>	n	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
4-057		3	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.57-1.68 (m, 4H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.86 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.70 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.84 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.63 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.22 (br s, 1H), 6.76 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 7.06 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 8.29 (s, 1H), 10.10 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 2 8



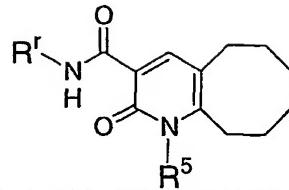
化合物 No.	R <sup>r</sup>	n	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
4-058		3	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.57-1.68 (m, 4H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.86 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.70 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.81 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.60 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.40 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 7.05 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 8.29 (s, 1H), 10.00 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-059		3	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.56-1.68 (m, 4H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.87 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.48 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 6.05 (br s, 1H), 6.53 (br s, 1H), 6.74 (s, 2H), 6.87 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 10.35 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-060		3	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.56-1.69 (m, 4H), 1.70 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.87 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.72 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.95 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.18 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.70 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 8.00 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 8.33 (s, 1H), 10.44 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-061		6	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.26-1.34 (m, 4H), 1.42 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.46-1.60 (m, 4H), 1.65 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.80 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.87 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.73 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.23-7.41 (m, 5H), 8.38 (s, 1H), 10.36 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H)
4-062		6	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.24-1.33 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.47-1.58 (m, 4H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.80 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.86 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.73 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.95 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.67 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.14 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.21-7.34 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.10 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 2 9



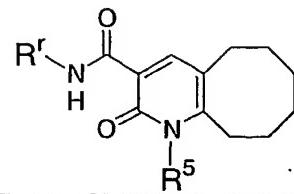
化合物 No.	$\text{R}'$	$^1\text{H-NMR} (\text{CDCl}_3)$
4-101		0.97 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.35-1.53 (m, 4H), 1.44 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.60-1.78 (m, 6H), 2.64 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.88 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.09 (br t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.64 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 7.17-7.39 (m, 5H), 8.34 (s, 1H), 10.34 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).
4-102		0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.34-1.53 (m, 4H), 1.46 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.62-1.80 (m, 6H), 2.64 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.89 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.94 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 3.67 (dt, $J = 9.0$ Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.10 (br t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 7.18-7.34 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.07 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).
4-103		0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.36-1.58 (m, 4H), 1.46 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.59-1.74 (m, 4H), 1.76 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.64 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.89 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.90 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 3.64 (dt, $J = 9.0$ Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.09 (br t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 6.98 (t, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.21 (dt, $J = 9.0$ Hz, 6.0 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 10.06 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).
4-104		0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.37-1.52 (m, 4H), 1.46 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.61-1.73 (m, 4H), 1.76 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.64 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.82 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.88 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.61 (dt, $J = 9.0$ Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.09 (br t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 6.64 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.05 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 10.02 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).
4-105		0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.36-1.52 (m, 4H), 1.45 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.60-1.72 (m, 4H), 1.76 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.63 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.85 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.88 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.63 (dt, $J = 9.0$ Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.10 (br t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 6.76 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.08 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 10.10 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).

表 3 0



化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
4-301			1.36 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.49 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.61-1.68 (m, 2H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.03 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.30 (s, 3H), 3.67 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 4.32 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.26-7.40 (m, 5H), 8.36 (s, 1H), 10.25 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-302			1.38 (quint, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 1.49 (quint, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 1.60-1.67 (m, 2H), 1.70 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.03 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.67 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 3.68 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 4.33 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 7.24-7.34 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 9.98 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-303			0.99 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 6H), 1.32-1.82 (m, 11H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.87 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.98-4.20 (br s, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.23-7.40 (m, 5H), 8.34 (s, 1H), 10.3 (t-like).
4-304			(CD <sub>3</sub> OD): 1.24-1.57 (m, 2H), 1.64-1.85 (m, 2H), 2.70 (t-like, 2H), 2.94 (t-like, 2H), 3.06 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.41 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.61 (s, 2H), 7.22-7.40 (m, 7H), 8.44 (A <sub>2</sub> B <sub>2</sub> , <i>J</i> = 5.2 Hz), 8.26 (d, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H).
4-305			1.32-1.82 (m, 14H), 2.38-2.53 (m, 4H), 2.57 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.26 (t-like, 1H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.22-7.39 (m, 5H), 8.34 (s, 1H), 10.29 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H).
4-306			1.32-1.50 (m, 4H), 1.52-1.72 (m, 4H), 2.17 (quint, <i>J</i> = 6.7 Hz, 2H), 2.52-2.70 (m, 4H), 3.98-4.10 (m, 2H), 4.10 (t, <i>J</i> = 6.7 Hz, 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 6.98 (s, 1H), 7.10 (s, 1H), 7.22-7.40 (m, 5H), 7.54 (s, 1H), 8.35 (s, 1H), 10.19 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H).

表 3 1



化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
4-307			1.34-1.54 (m, 4H), 1.60-1.81 (m, 4H), 1.82-1.94 (m, 2H), 2.28-2.50 (m, 6H), 2.64 (t, J = 6.4 Hz, 2H), 2.93 (t, J = 6.4 Hz, 2H), 3.70 (t, J = 4.5 Hz, 2H), 4.17 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 4.64 (d, J = 5.8 Hz, 2H), 7.20-7.39 (m, 5H), 8.34 (s, 1H), 10.29 (t-like, 1H).
4-308			1.30-1.42 (m, 2H), 1.42-1.52 (m, 2H), 1.60-1.80 (m, 4H), 2.64 (t, J = 5.9 Hz, 2H), 2.79 (t, J = 6.1 Hz, 2H), 3.01 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 4.31 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 4.87 (t, J = 5.8 Hz, 2H), 7.14-7.28 (m, 2H), 7.30-7.42 (m, 4H), 7.57 (ddd, J = 6.0, 1.9, 1.9 Hz, 2H), 8.38 (s, 1H), 8.51 (d-like, 2H), 10.3 (t, J = 5.8 Hz, 1H).
4-309			1.37-1.53 (m, 4H), 1.60-1.80 (m, 4H), 2.66 (t, J = 6.1 Hz, 2H), 2.81 (t, J = 6.4 Hz, 2H), 4.64 (t, J = 5.8 Hz, 2H), 5.44 (br s, 2H), 7.20-7.42 (m, 7H), 8.45 (s, 1H), 8.45-8.58 (m, 2H), 10.1 (t, J = 5.8 Hz, 1H).
4-310			1.35-1.55 (m, 4H), 1.60-1.80 (m, 4H), 2.68 (t, J = 5.9 Hz, 2H), 2.74 (t, J = 6.1 Hz, 2H), 4.62 (t, J = 5.8 Hz, 2H), 5.42 (br s, 2H), 6.97 (A <sub>2</sub> B <sub>2</sub> , J = 6.1 Hz, 2H), 7.19-7.37 (m, 5H), 8.47 (s, 1H), 8.54-8.58 (m, 2H), 10.1 (t-like, 1H).

表 3 2

化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
4-311		0.99 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 1.36-1.75 (m, 12H), 2.62 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.08 (brs, 2H), 5.31 (m, 1H), 7.14-7.42 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.35 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
4-312		0.99 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 1.36-1.75 (m, 12H), 2.62 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.08 (brs, 2H), 5.31 (m, 1H), 7.14-7.42 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.35 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
4-313		0.98 (t, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.40-1.76 (m, 12H), 1.42 (s, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H), 3.19 (s, 2H), 4.07 (brs, 2H), 7.16-7.26 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 9.87 (s, 1H).
4-314		0.98 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 1.39-1.76 (m, 12H), 2.64 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.93 (dd, <i>J</i> = 11.4, 4.5 Hz, 1H), 3.97 (dd, <i>J</i> = 11.4, 6.9 Hz, 1H), 4.10 (brs, 2H), 5.31 (m, 1H), 7.27-7.46 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.75 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H).
4-315		0.98 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 1.39-1.76 (m, 12H), 2.64 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.93 (dd, <i>J</i> = 11.4, 4.5 Hz, 1H), 3.97 (dd, <i>J</i> = 11.4, 6.9 Hz, 1H), 4.10 (brs, 2H), 5.31 (m, 1H), 7.27-7.46 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.75 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H).
4-316		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32-1.76 (m, 12H), 2.63 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.91 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 4.12 (brs, 2H), 5.54 (m, 1H), 7.28-7.45 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.77 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
4-317		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32-1.76 (m, 12H), 2.63 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.91 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 4.12 (brs, 2H), 5.54 (m, 1H), 7.28-7.45 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.77 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
4-318		0.97 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 1.38-1.75 (m, 12H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.2 Hz, 2H), 2.99 (dd, <i>J</i> = 16.0, 6.6 Hz, 2H), 3.41 (dd, <i>J</i> = 16.0, 7.5 Hz, 2H), 4.07 (brs, 2H), 4.88 (m, 1H), 7.15-7.24 (m, 4H), 8.32 (s, 1H), 10.17 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 3 3

化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
4-319		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.25-1.77 (m, 12H), 2.18 (m, 1H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 3.14 (m, 1H), 4.10 (brs, 2H), 7.16-7.30 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.12 (d, <i>J</i> = 3.6 Hz, 1H).
4-320		1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30-1.55 (m, 6H), 1.59 (s, 6H), 1.56-1.89 (m, 6H), 2.58 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.00-4.23 (m, 2H), 7.10-7.40 (m, 5H), 7.46 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 8.23 (s, 1H).
4-321		1.35-2.04 (m, 8H), 2.03-2.15 (m, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88-2.96 (m, 4H), 3.63-3.71 (m, 2H), 3.78 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.05 (dd, <i>J</i> = 6.9, 2.1 Hz, 2H), 4.18-4.27 (m, 3H), 6.49 (dd, <i>J</i> = 14.1, 6.6 Hz, 1H), 7.15-7.35 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.01 (brs, 1H).
4-322		1.35-2.04 (m, 8H), 2.03-2.15 (m, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88-2.96 (m, 4H), 3.63-3.71 (m, 2H), 3.78 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.05 (dd, <i>J</i> = 6.9, 2.1 Hz, 2H), 4.18-4.27 (m, 3H), 6.49 (dd, <i>J</i> = 14.1, 6.6 Hz, 1H), 7.15-7.35 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.01 (brs, 1H).
4-323		1.20-1.90 (m, 8H), 2.13-2.28 (m, 2H), 2.55-2.72 (m, 2H), 2.82-3.02 (m, 2H), 3.62-3.78 (m, 2H), 4.20-4.38 (m, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 7.18-7.43 (m, 5H), 8.36 (s, 1H).
4-324		1.20-1.90 (m, 8H), 2.12-2.28 (m, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.6 Hz, 2H), 2.92-3.02 (m, 4H), 3.60-3.78 (m, 4H), 4.29 (t, <i>J</i> = 9.0 Hz, 2H), 7.10-7.40 (m, 5H), 8.33 (s, 1H).
4-325		1.37-1.80 (m, 8H), 2.02 (m, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.6 Hz, 2H), 3.77 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 4.04 (dd, <i>J</i> = 6.9, 2.1 Hz, 1H), 4.16-4.26 (m, 3H), 4.65 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 6.48 (dd, <i>J</i> = 14.1, 6.6 Hz, 1H), 7.21-7.42 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.29 (brs, 1H).
4-326		1.37 (m, 8H), 2.07 (m, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90-2.96 (m, 4H), 3.63-3.71 (m, 2H), 3.78 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.05 (dd, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2.1 Hz, 1H), 4.18-4.27 (m, 3H), 6.49 (dd, <i>J</i> = 14.1, 6.6 Hz, 1H), 7.18-7.33 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.01 (brs, 1H).

表 3 4

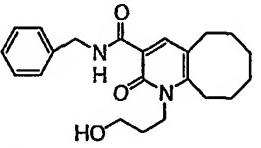
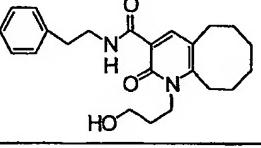
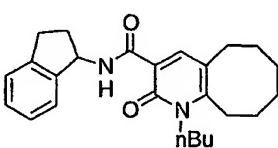
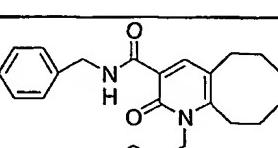
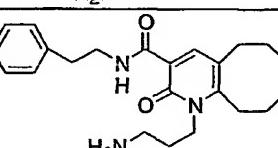
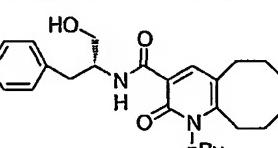
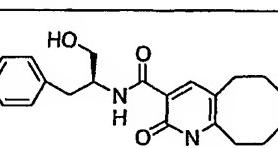
化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
4-327		1.38-1.81 (m, 8H), 1.88-1.96 (m, 2H), 2.66 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 2.93 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 3.52 (t, J = 5.1 Hz, 2H), 3.72 (brs, 1H), 4.65 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 7.22-7.38 (m, 5H), 8.40 (s, 1H), 10.18 (brs, 1H).
4-328		1.38-1.95 (m, 10H), 2.65 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.90-2.94 (m, 4H), 3.45-3.52 (m, 2H), 3.65-3.72 (m, 2H), 3.91 (brs, 1H), 4.34 (brs, 2H), 7.20-7.35 (m, 5H), 8.37 (s, 1H), 9.88 (brs, 1H).
4-329		0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.30-1.55 (m, 6H), 1.55-1.82 (m, 6H), 1.97 (ddd, J = 16.5, 12.9, 8.4 Hz, 1H), 2.60-2.73 (m, 3H), 2.84-2.96 (m, 3H), 3.03 (ddd, J = 16.5, 9.3, 3.6 Hz, 1H), 3.93-4.20 (m, 2H), 5.67 (q-like, 1H), 7.10-7.35 (m, 3H), 7.38 (m, 1H), 8.37 (s, 1H).
4-330		1.25-1.28 (m, 14H), 2.65 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.80 (brs, 2H), 2.92 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.22 (m, 2H), 4.65 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.39 (m, 5H), 8.36 (s, 1H), 10.25 (brs, 1H).
4-331		1.37-1.90 (m, 12H), 2.64 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 2.80 (m, 2H), 2.90-2.96 (m, 4H), 3.68 (q, J = 6.3 Hz, 2H), 4.23 (brs, 2H), 7.21-7.33 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 9.98 (brs, 1H).
4-332		1.00 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.33-1.54 (m, 6H), 1.55-1.79 (m, 6H), 2.63 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 2.98 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 3.66 (dd, J = 10.1, 6.3 Hz, 1H), 3.79 (dd, J = 10.1, 3.6 Hz, 1H), 4.33 (m, 1H), 7.18-7.40 (m, 5H), 8.27 (s, 1H).
4-333		1.00 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.33-1.54 (m, 6H), 1.55-1.79 (m, 6H), 2.63 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 2.98 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 3.66 (dd, J = 10.1, 6.3 Hz, 1H), 3.79 (dd, J = 10.1, 3.6 Hz, 1H), 4.33 (m, 1H), 7.18-7.40 (m, 5H), 8.27 (s, 1H).

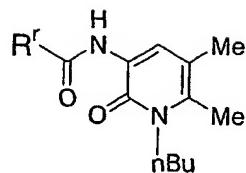
表 3 5

化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
4-501		0.95 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66-1.77 (m, 6H), 2.57 (br t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.27 (br t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.92 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.60 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 7.12 (s, 1H), 7.23-7.40 (m, 5H), 9.58 (br t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H).
4-502		0.95 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66-1.77 (m, 6H), 2.56 (br t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.27 (br t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.92 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.92 (s, 2H), 6.75 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 6.83 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 6.88 (s, 1H), 7.13 (s, 1H), 9.58 (br s, 1H).
4-503		0.95 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.65-1.77 (m, 6H), 2.56 (br t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.27 (br t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.91 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.53 (s, 2H), 6.86 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 7.12 (s, 1H), 7.30 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 9.54 (br s, 1H).
4-504		0.95 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.66-1.78 (m, 6H), 2.56 (br t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.27 (br t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.92 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.58 (s, 2H), 6.27 (dd, <i>J</i> = 3.0 Hz, 0.9 Hz, 1H), 6.30 (dd, <i>J</i> = 3.0 Hz, 1.8 Hz, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.35 (dd, <i>J</i> = 1.8 Hz, 0.9 Hz, 1H), 9.65 (br s, 1H).
4-505		0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63-1.78 (m, 4H), 1.87 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.57 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.73 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.90 (s, 3H), 4.02 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.92 (s, 1H).

表 3 6

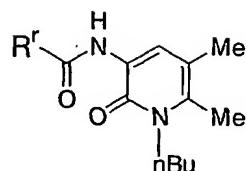
化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR ( $\text{CDCl}_3$ )
4-506		0.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.42 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.60-1.77 (m, 4H), 1.84 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.54 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.70 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.88 (s, 3H), 4.02 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.75 (s, 2H), 7.17-7.40 (m, 6H). (minor isomer): $\delta$ 0.95 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.41 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.60-1.77 (m, 4H), 1.83 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.50 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.68 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.97 (s, 3H), 4.01 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.49 (s, 2H), 7.17-7.40 (m, 6H).
4-507		0.89 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.30 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.92 (quint, $J = 6.9$ Hz, 2H), 2.57, 2.77 (ABq, $J = 9.0$ Hz, 2H), 2.58, 2.76 (ABq, $J = 7.5$ Hz, 2H), 3.93 (s, 3H), 4.30 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.31-7.41 (m, 3H), 7.56 (dd, $J = 7.2$ Hz, 2.4 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H).
4-508		0.91 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.30 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.91 (quint, $J = 6.6$ Hz, 2H), 2.65, 2.80 (ABq, $J = 9.0$ Hz, 2H), 2.66, 2.79 (ABq, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.42 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.38-7.46 (m, 3H), 7.57 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 14.77 (br s, 1H).
4-509		0.88 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.27 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.87 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.62, 2.78 (ABq, $J = 9.0$ Hz, 2H), 2.64, 2.76 (ABq, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.35 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.68 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 7.21-7.41 (m, 8H), 7.53 (dd, $J = 6.9$ Hz, 2.4 Hz, 1H), 8.46 (s, 1H), 10.33 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).
4-510		0.90 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.29 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.87 (quint, $J = 6.6$ Hz, 2H), 2.62, 2.78 (ABq, $J = 9.0$ Hz, 2H), 2.63, 2.76 (ABq, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 3.66-3.74 (m, 2H), 4.36 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.19-7.37 (m, 8H), 7.53 (dd, $J = 6.9$ Hz, 2.4 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 10.06 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).

表 3 7



化合物 No.	R <sup>r</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
5-001	Me	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.50 (m, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 2.12 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 8.20 (s, 1H), 8.35 (br s, 1H).
5-002		1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.64-1.74 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 4.14 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.44-7.57 (m, 3H), 7.92-7.95 (m, 2H), 8.41 (s, 1H), 9.22 (br s, 1H).
5-003		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.39-1.52 (m, 2H), 1.64-1.74 (m, 2H), 2.16 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.15-7.24 (m, 1H), 7.30 (dd, 1.8, 8.4 Hz, 1H), 7.47-7.54 (m, 1H), 8.12 (dt, 1.8, 7.8 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 9.75 (br s, 1H).
5-004		1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.63-1.74 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.12-7.18 (m, 2H), 7.93-7.97 (m, 2H), 8.37 (s, 1H), 9.16 (br s, 1H).
5-005		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.64-1.72 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 4.11 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.31-7.47 (m, 3H), 7.73 (dd, <i>J</i> = 2.1, 7.2 Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 9.13 (br s, 1H).
5-006		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.61-1.72 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.53 (s, 3H), 4.11 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.20-7.26 (m, 2H), 7.32-7.37 (m, 1H), 7.54 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.74 (br s, 1H).
5-007		1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.64-1.74 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.35 (m, 2H), 7.74 (m, 2H), 8.41 (s, 1H), 9.21 (br s, 1H).
5-008		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.64-1.74 (m, 2H), 2.16 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.27 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 7.84 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 8.40 (s, 1H), 9.20 (br s, 1H).
5-009		1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.64-1.74 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.20-7.27 (m, 1H), 7.41-7.48 (m, 1H), 7.63-7.70 (m, 2H), 8.38 (s, 1H), 9.19 (br s, 1H).
5-010		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.62-1.73 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 4.12 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.46-7.59 (m, 3H), 7.79 (dd, <i>J</i> = 1.2, 7.2 Hz, 1H), 7.88 (dd, 1.5, 7.2 Hz, 1H), 7.95 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 8.45 (dd, <i>J</i> = 1.5, 7.5 Hz, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.95 (br s, 1H).
5-011		1.01 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.42-1.54 (m, 2H), 1.66-1.76 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 4.16 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.53-7.62 (m, 2H), 7.88-8.03 (m, 4H), 8.47 (s, 2H), 9.41 (br s, 1H).

表 3 8

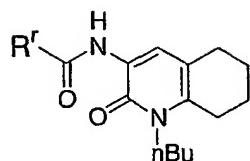


化合物 No.	R <sup>r</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
5-012		0.96 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.35-1.47 (m, 2H), 1.57-1.67 (m, 2H), 2.09 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 3.72 (s, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.28-7.40 (m, 5H), 8.22 (s, 1H), 8.40 (br s, 1H).
5-013		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 2.12 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.69 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.04 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.17-7.34 (m, 5H), 8.23 (s, 1H), 8.35 (br s, 1H).
5-014		0.92 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.31-1.39 (m, 2H), 1.51-1.62 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.54-7.64 (m, 3H), 7.83 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.99 (s, 1H), 13.06 (br s, 1H).
5-015	nBuO-	0.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.49 (m, 4H), 1.60-1.70 (m, 4H), 2.11 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.15 (t, <i>J</i> = 6.6 Hz, 2H), 7.73 (br s, 1H), 7.85 (br s, 1H).
5-016		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.39-1.51 (m, 2H), 1.62-1.73 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.16-7.41 (m, 5H), 7.88 (s, 1H), 8.09 (br s, 1H).
5-017	BnO-	0.97 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.48 (m, 2H), 1.59-1.69 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.08 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 5.19 (s, 2H), 7.26-7.41 (m, 5H), 7.83 (s, 1H), 7.86 (s, 1H).
5-018		0.90 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.27-1.40(m, 2H), 1.57-1.67(m, 2H), 2.14(s, 3H), 2.31(s, 3H), 4.09(t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.91-6.97(m, 1H), 7.28-7.34(m, 1H), 7.49(br s, 1H), 7.50-7.54(m, 1H), 8.08-8.11(m, 1H), 8.10(s, 1H), 8.38(br s, 1H).
5-019		1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.39-1.51 (m, 2H), 1.61-1.71 (m, 2H), 2.15 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 4.15 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.98-7.03 (m, 1H), 7.25-7.30 (m, 2H), 7.41-7.45 m, 2H), 8.03 (s, 1H).
5-020		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.42-1.75 (m, 4H), 2.12 (s, 3H), 4.27 (t, <i>J</i> = 7.8Hz, 2H), 7.48-7.61 (m, 3H), 8.04-8.09 (m, 3H), 8.98 (s, 1H), 10.35 (br s, 1H).

表 3 9

化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
5-101		0.97 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.49 (m, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 2.04 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 4.08 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.51 (s, 2H), 6.27 (s, 1H), 7.30-7.35 (m, 2H), 7.48-7.52 (m, 1H), 7.69-7.72 (m, 1H).
5-102		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.59-1.69 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.23-7.43 (m, 1H), 7.42-7.43 (m, 4H), 8.86 (s, 1H).
5-103		0.92 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.25-1.37 (m, 2H), 1.45-1.55 (m, 2H), 2.08 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 3.97 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.35 (s, 1H), 7.41-7.55 (n, 2H), 7.65 (br s, 1H), 7.83-7.87 (m, 2H).
5-104		0.95 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.33-1.45 (m, 2H), 1.59-1.70 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.03 (s, 1H), 7.28-7.44 (m, 6H), 7.79-7.82 (m, 4H).
5-105		0.96 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.62-1.73 (m, 2H), 2.16 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 4.11 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 7.30 (s, 1H), 7.72-7.77 (m, 2H), 7.88-7.94 (m, 2H).
5-106		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.64-1.75 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 4.15 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.38-7.50 (m, 3H), 7.89-7.92 (m, 2H), 9.57 (s, 1H), 10.60 (br s, 1H).

表 4 0



化合物 No.	R'	<sup>1</sup> H-NMR ( $\text{CDCl}_3$ )
6-001		0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.45 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.66 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.74 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 1.87 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.60 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.69 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.06 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 7.43-7.56 (m, 3H), 7.94 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 9.26 (br s, 1H).
6-002		0.95 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.40 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.56-1.65 (m, 2H), 1.69 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 1.82 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.52 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.62 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.72 (s, 2H), 3.98 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 7.27-7.39 (m, 5H), 8.13 (s, 1H), 8.44 (br s, 1H).
6-003		0.97 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.42 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.61 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.71 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 1.84 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.55 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.65 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.70 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 3.04 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.02 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 7.18-7.33 (m, 5H), 8.15 (s, 1H), 8.41 (br s, 1H).
6-004		0.98 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.41 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.64 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.72 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 1.85 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.57 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.67 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.03 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.60 (s, 2H), 7.03 (d, $J = 7.8$ Hz, 2H), 7.32 (d, $J = 7.8$ Hz, 3H), 8.19 (s, 1H), 9.49 (br s, 1H).
6-005		0.92 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.32 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.57-1.65 (m, 2H), 1.69 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 1.82 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.55 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.59 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.90 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.46 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 5.72 (br s, 1H), 7.24-7.32 (m, 5H), 7.95 (s, 1H), 8.00 (br s, 1H).
6-006		(in $d_6$ -DMSO): 0.93 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.35 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.56 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 1.71-1.80 (m, 2H), 2.51 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.67 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.00 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 6.96 (t, $J = 7.2$ Hz, 1H), 7.27 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.43 (d, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.84 (s, 1H), 8.53 (br s, 1H), 9.51 (br s, 1H).
6-007		0.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.41 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.63 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.70 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 1.83 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.53 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.63 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.01 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 5.19 (s, 2H), 7.29-7.41 (m, 5H), 7.76 (s, 1H), 7.86 (br s, 1H).

表 4 1

化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
7-001		0.71 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.10-1.23(m, 2H), 1.46-1.55(m, 2H), 2.22(s, 3H), 2.43(s, 3H), 4.28 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 7.20-7.29(m, 2H), 7.38-7.41(m, 1H), 7.58-7.60(m, 1H), 7.67(s, 1H).
7-002		0.97 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.49(m, 2H), 1.60-1.80 (m, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.48 (s, 3H), 4.71(br s, 2H), 7.30-7.35 (m, 3H), 8.01 (s, 1H), 8.04 (s, 1H).
7-003		0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.50(m, 2H), 1.62-1.73 (m, 2H), 2.07 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.96 (s, 1H).
7-004		2.07 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 3.88 (s, 3H), 5.42 (br s, 2H), 7.19-7.54 (m, 9H).
7-005		1.10 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.53 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.85 (s, 3H), 5.41 (br s, 2H), 7.18-7.55 (m, 9H).
7-006		0.84 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.28 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.68 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 4.42 (t, <i>J</i> = 6.6 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.1 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 7.26-7.37 (m, 5H), 8.32 (br s, 1H), 8.42 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
7-007		0.95 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.39 (m, 2H), 1.74 (m, 2H), 3.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.50 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.60 (d, 5.7 Hz, 1H), 5.9 (brs, 1H), 6.36 (brs, 1H), 6.56 (dd, <i>J</i> = 9.6, 3.6 Hz, 1H), 7.25-7.36 (m, 5H), 7.86 (m, 1H), 8.22 (m, 2H).
7-008		0.96 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.32-1.45(m, 2H), 1.69-1.79 (m, 2H), 3.96 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 4.44 (s, 2H), 7.19-7.30 (m, 3H), 7.40-7.43 (m, 1H), 7.59-7.62 (m, 1H), 7.66 (dd, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H).
7-009		0.96 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.32-1.44(m, 2H), 1.68-1.79 (m, 2H), 3.96 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 6.14 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.06-7.27 (m, 5H), 7.39 (dd, <i>J</i> = 1.8, 7.0 Hz, 1H).

表 4 2

化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
7-010		(in CDCl <sub>3</sub> + CD <sub>3</sub> OD): 2.17 (quint, <i>J</i> =6.3 Hz, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> =6.3 Hz, 2H), 3.09 (t, <i>J</i> =6.3 Hz, 2H), 8.34 (s, 1H).

表 4 3

化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR ( $\text{CDCl}_3$ )
7-011		0.97 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.38 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.76 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.15 (quint, $J = 6.3$ Hz, 2H), 2.61 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.06 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 4.03 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 8.39 (s, 1H).
7-012		0.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.37 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.67-1.86 (m, 6H), 2.54 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 2.87 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.93 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.22 (s, 1H).
7-013		0.97 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.38 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.76 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.15 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.61 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.06 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.45-3.58 (m, 1H), 4.03 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 8.39 (s, 1H).
7-014		0.98 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.41 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.75-1.90 (m, 6H), 2.60 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 2.87 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 4.81 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.50 (s, 1H).
7-015		0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.44 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.74 (quint, $J = 3.3$ Hz, 4H), 1.87 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.62 (br t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 2.95 (br t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 4.51 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.53 (s, 1H), 10.60 (s, 1H).
7-016		0.99 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.43 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.71-1.95 (m, 6H), 2.66 (br t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 2.83 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 4.58 (br t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 4.79 (s, 2H), 7.61 (s, 1H).
7-017		0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.43 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.70-1.95 (m, 6H), 2.62 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.01 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 4.58 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 5.05 (s, 2H), 7.15-7.30 (m, 2H), 7.42 (dd, $J = 7.2$ Hz, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.48 (br s, 1H), 7.60 (dd, $J = 7.2$ Hz, $J = 1.8$ Hz, 1H).
7-018		0.93 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.32 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.42-1.59 (m, 5H), 1.88 (s, 1H), 1.97-2.08 (m, 2H), 2.20-2.32 (m, 1H), 2.54-2.66 (m, 1H), 3.06-3.19 (m, 2H), 3.33-3.43 (m, 3H).
7-019		0.98 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.43 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.65 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.71 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 1.85 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.52 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.68 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.00 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.53 (s, 2H), 7.02 (s, 1H).

表 4 4

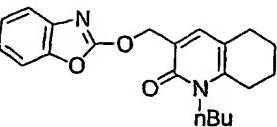
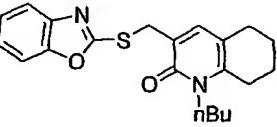
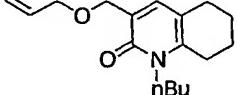
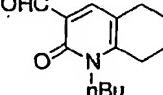
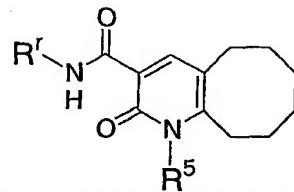
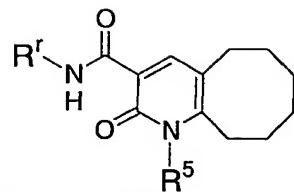
化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
7-020		0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.57-1.72 (m, 4H), 1.81 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.45 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.93 (s, 2H), 7.08-7.30 (m, 4H), 7.13 (s, 1H).
7-021		0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.59-1.73 (m, 4H), 1.81 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.49 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.43 (s, 2H), 7.24 (quint d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1.5 Hz, 2H), 7.40 (s, 1H), 7.42 (dd, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1.5 Hz, 1H), 7.60 (dd, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1.5 Hz, 1H).
7-022		0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.42 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.64 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.70 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.84 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.53 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.99 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.12 (dt, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1.5 Hz, 2H), 4.46 (s, 2H), 5.20 (dq, <i>J</i> = 10.5 Hz, 1.8 Hz, 1H), 5.33 (dq, <i>J</i> = 17.1 Hz, 1.8 Hz, 1H), 5.91-6.05 (m, 1H), 7.19 (s, 1H).
7-023		0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.68 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.59 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.76 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.76 (s, 1H), 10.34 (s, 1H).

表 4 5



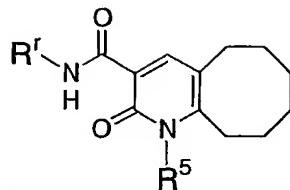
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-001		nBu	0.99 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.22-1.53 (m, 6H), 1.62-1.86 (m, 6H), 2.36-2.42 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.48 (dt, <i>J</i> = 7.2, 6.9 Hz, 2H), 3.72 (t, <i>J</i> = 4.8 Hz, 4H), 4.05-4.14 (m, 2H), 8.29 (s, 1H), 10.1 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H).
10-002		nBu	0.98 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.54 (m, 6H), 1.62-1.83 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.05-4.20 (m, 2H), 4.80 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 2H), 7.16 (m, 1H), 7.35 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.64 (ddd, <i>J</i> = 7.8, 7.8, 1.8 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.59 (dlike, 1H), 10.6 (t, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H).
10-003		nBu	0.99 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.53 (m, 6H), 1.60-1.90 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.70 (dt, <i>J</i> = 7.5, 6.0 Hz, 2H), 4.03-4.14 (m, 2H), 7.18-7.20 (m, 2H), 8.29 (s, 1H), 8.50-8.52 (m, 2H), 10.1 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
10-004		nBu	0.99 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34-1.54 (m, 6H), 1.62-1.85 (m, 6H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.12 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.28 (A2B2, <i>J</i> = 5.0 Hz, 2H), 8.53 (s, 1H), 8.54 (A2B2, <i>J</i> = 5.0 Hz, 2H), 10.5 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H).
10-005		nBu	0.99 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.54 (m, 6H), 1.60-1.82 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.68 (dt, <i>J</i> = 7.5, 6.3 Hz, 2H), 4.04-4.14 (m, 2H), 7.23 (dd, <i>J</i> = 7.8, 4.6 Hz, 1H), 7.59 (ddd, <i>J</i> = 7.8, 2.1, 1.5 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.47 (dd, <i>J</i> = 7.8, 1.5 Hz, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz, 1H), 10.1 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H).
10-006		nBu	0.98 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.53 (m, 6H), 1.41 (s, 6H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 3.16 (s, 2H), 4.06 (br.s, 2H), 6.88-6.94 (m, 2H), 7.11-7.16 (m, 2H), 8.32 (s, 1H), 9.83 (br.s, 1H).

表 4 6



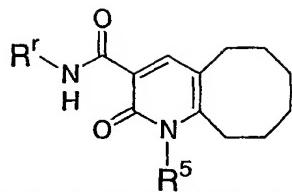
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-007		nBu	0.98 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.49 (m, 6H), 1.51-1.80 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.10 (br.s, 2H), 4.73 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.16-7.25 (m, 4H), 7.35 (m, 1H), 7.46 (m, 1H), 8.32 (s, 1H), 10.4 (br.s, 1H).
10-008		nBu	0.98 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.37-1.48 (m, 6H), 1.51-1.79 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 2.87 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 3.88 (s, 3H), 4.09 (m, 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 6.85-6.93 (m, 2H), 7.22 (dt, <i>J</i> = 7.6, 1.8 Hz, 1H), 7.35 (dd, <i>J</i> = 7.6, 1.8 Hz, 1H), 8.32 (s, 1H), 10.3 (br.s, 1H).
10-009		nBu	0.97 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 6H), 1.60-1.80 (m, 6H), 2.38 (s, 3H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.08 (m, 2H), 4.63 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 2H), 7.15-7.20 (m, 3H), 7.33 (m, 1H), 8.33 (s, 1H), 10.2 (br.s, 1H).
10-010		nBu	0.97 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.36-1.50 (m, 6H), 1.61-1.78 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 2.87 (t, <i>J</i> = 6.7 Hz, 2H), 4.08 (br.s, 2H), 4.72 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 2H), 6.84-6.92 (m, 2H), 7.20 (m, 1H), 8.32 (s, 1H), 10.2 (br.s, 1H).
10-011		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34-1.54 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.65-1.81 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.71 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 5.43 (dt, <i>J</i> = 8.1 Hz, 6.0 Hz, 1H), 7.26-7.70 (m, 5H), 8.23 (s, 1H), 10.74 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-012		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34-1.56 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.06 (s, 3H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.15 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 5.25 (dt, <i>J</i> = 7.8 Hz, 6.0 Hz, 1H), 7.35-7.42 (m, 5H), 8.28 (s, 1H), 10.67 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).

表 4 7



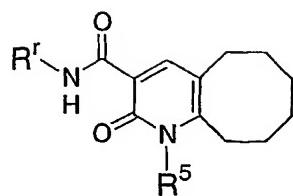
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-013		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.34-1.55 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.62-1.80 (m, 6H), 2.01 (s, 3H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.78-3.06 (m, 4H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.35-4.45 (m, 1H), 7.18-7.30 (m, 5H), 8.24 (s, 1H), 10.25 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-014		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.55 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63-1.79 (m, 6H), 1.97 (s, 3H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.70-3.81 (m, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.31-5.39 (m, 1H), 6.61 (br t, <i>J</i> = 4.5 Hz, 1H), 7.28-7.44 (m, 5H), 8.28 (s, 1H), 10.66 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-015		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.57 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.62-1.80 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.60 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 5.38 (dt, <i>J</i> = 7.5 Hz, 6.0 Hz, 1H), 7.35-7.43 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.75 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H).
10-016		nBu	0.99 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.54 (m, 6H), 1.62-1.82 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.06-4.17 (m, 2H), 4.68 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 7.16 (dd, <i>J</i> = 8.5, 2.4 Hz, 1H), 7.28 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H), 7.41 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.32 (s, 1H), 10.5 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H).
10-017		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.35-1.57 (m, 6H), 1.65-1.85 (m, 6H), 2.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.2 Hz, 2H), 4.08-4.20 (m, 2H), 6.33 (s, 1H), 6.48 (dd, <i>J</i> = 3.4, 1.8 Hz, 1H), 6.68 (d, <i>J</i> = 3.4 Hz, 1H), 7.46 (m, 1H), 8.35 (s, 1H), 12.8 (s, 1H).

表 4 8



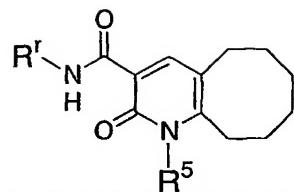
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-018		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.57 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.28-3.33 (m, 1H), 3.45-3.55 (m, 1H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.40-4.50 (m, 1H), 4.53 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 5.14-5.30 (m, 2H), 5.52 (br s, 1H), 5.82-5.96 (m, 1H), 7.17-7.28 (m, 5H), 8.25 (s, 1H), 10.18 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-019		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40 (s, 9H), 1.41-1.55 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.64-1.80 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88-3.00 (m, 2H), 3.18-3.28 (m, 1H), 3.38-3.48 (m, 1H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.37-4.47 (m, 1H), 5.11 (br s, 1H), 7.22-7.32 (m, 5H), 8.25 (s, 1H), 10.13 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-020		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.81 (m, 12H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74-3.04 (m, 6H), 3.21-3.37 (m, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.44-4.53 (m, 1H), 5.06-5.17 (m, 2H), 5.08-5.95 (m, 1H), 7.18-7.29 (m, 5H), 8.25 (s, 1H), 10.17 (br s, 1H).
10-021		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.52 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.61-1.79 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.95-3.11 (m, 2H), 3.49-3.59 (m, 1H), 3.68-3.76 (m, 1H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.51-4.64 (m, 1H), 7.17-7.85 (m, 10H), 7.92 (br s, 1H), 8.27 (s, 1H), 10.45 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-022		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.57 (m, 4H), 1.48 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.80 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.96-3.12 (m, 2H), 3.46-3.56 (m, 1H), 3.70-3.79 (m, 1H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.51-4.63 (m, 1H), 7.17-7.39 (m, 6H), 8.17 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.37 (br s, 1H), 8.69 (d, <i>J</i> = 3.9 Hz, 1H), 9.07 (br s, 1H), 10.52 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).

表 4 9



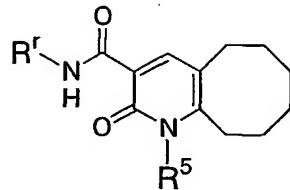
化合物 No.	$\text{R}^r$	$\text{R}^5$	$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ )
10-023		nBu	1.01 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.39-1.59 (m, 4H), 1.50 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.63-1.85 (m, 6H), 2.68 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.94 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.17 (br t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.46-7.61 (m, 3H), 8.11 (d, $J = 7.2$ Hz, 2H), 8.42 (s, 1H), 13.76 (br s, 1H).
10-024	H-	nBu	0.99 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.37-1.56 (m, 4H), 1.47 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.63-1.81 (m, 6H), 2.64 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.90 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.11 (t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 5.69 (br s, 1H), 8.30 (s, 1H), 9.63 (br s, 1H).
10-025		nBu	1.00 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.37-1.84 (m, 12H), 2.69 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.94 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.13 (br t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.50-7.53 (m, 3H), 8.00-8.08 (m, 2H), 8.37 (s, 1H), 13.04 (br s, 1H).
10-026		nBu	1.00 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.38-1.57 (m, 4H), 1.48 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.63-1.87 (m, 6H), 2.68 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.94 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.16 (br t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 7.40-7.56 (m, 3H), 7.95 (d, $J = 7.2$ Hz, 2H), 8.42 (s, 1H), 14.37 (br s, 1H).
10-027		nBu	0.99 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.38-1.56 (m, 4H), 1.47 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.63-1.82 (m, 6H), 2.62 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.90 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.11 (br t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 6.12 (br s, 1H), 7.39-7.51 (m, 3H), 7.75-7.79 (m, 2H), 8.12 (s, 1H).
10-028		nBu	1.01 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.37-1.58 (m, 4H), 1.48 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.60-1.82 (m, 6H), 2.60 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.91 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.06 (s, 3H), 4.17 (br t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.36-7.56 (m, 3H), 7.52-7.57 (m, 2H), 8.23 (s, 1H), 12.43 (br s, 1H).
10-029		nBu	1.01 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.37-1.55 (m, 4H), 1.40 (t, $J = 6.9$ Hz, 3H), 1.48 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.60-1.83 (m, 6H), 2.60 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.91 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.17 (br t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.30 (q, $J = 6.9$ Hz, 2H), 7.32-7.40 (m, 3H), 7.51-7.61 (m, 2H), 8.23 (s, 1H), 12.44 (br s, 1H).

表 50



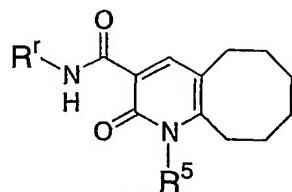
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-030			1.37-1.53 (m, 4H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.61-1.79 (m, 4H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.72 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 5.30 (quint, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 5.42 (br s, 2H), 6.98 (d, <i>J</i> = 5.1 Hz, 2H), 7.25-7.41 (m, 5H), 8.43 (s, 1H), 8.58 (br s, 2H), 10.11 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-031			1.37-1.80 (m, 8H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.07 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 3.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 5.30 (q, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 5.45 (br s, 2H), 6.99 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 7.29-7.42 (m, 5H), 8.44 (s, 1H), 8.57 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 10.50 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-032		nBu	0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.58 (m, 6H), 1.60-1.80 (m, 6H), 1.92-2.05 (m, 1H), 2.62-2.73 (m, 1H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.84-2.95 (m, 1H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.99-3.09 (m, 1H), 3.95-4.16 (m, 2H), 5.68 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.15-7.29 (m, 3H), 7.36-7.40 (m, 1H), 8.37 (s, 1H), 10.25 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).
10-033		nBu	0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.56 (m, 6H), 1.59-1.79 (m, 6H), 1.91-2.04 (m, 1H), 2.62-2.72 (m, 1H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.84-2.95 (m, 1H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.99-3.09 (m, 1H), 3.98-4.18 (m, 2H), 5.68 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.15-7.26 (m, 3H), 7.36-7.40 (m, 1H), 8.37 (s, 1H), 10.25 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-034		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.56 (m, 4H), 1.48 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63-1.83 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.29 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.82 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 6.90 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 7.22-7.27 (m, 2H), 8.34 (s, 1H), 11.48 (br s, 1H).
10-035		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.20-1.53 (m, 12H), 1.59-1.80 (m, 8H), 1.95-2.01 (m, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.91-4.02 (m, 1H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 9.88 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-036		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.13-1.30 (m, 2H), 1.36-1.83 (m, 21H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.28 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 9.98 (br s, 1H).

表 5 1



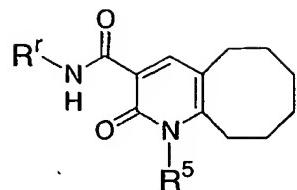
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-037	Me	nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.53 (m, 6H), 1.62-1.81 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.98 (d, <i>J</i> = 3.6 Hz, 3H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 9.85 (br s, 1H).
10-038	Et	nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.24 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34-1.54 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.63-1.80 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.42-3.51 (m, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 9.90 (br s, 1H).
10-039	iPr	nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.26 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 6H), 1.34-1.52 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.60-1.80 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.25 (sextet, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 8.31 (s, 1H), 9.82 (br s, 1H).
10-040	tBu	nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.56 (m, 6H), 1.47 (s, 9H), 1.61-1.79 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 9.92 (br s, 1H).
10-041		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.01 (s, 9H), 1.36-1.57 (m, 6H), 1.62-1.80 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.27 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.32 (s, 1H), 10.10 (br s, 1H).
10-042		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.54 (m, 6H), 1.62-1.83 (m, 6H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.14 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.15-7.30 (m, 2H), 7.47-7.56 (m, 1H), 7.96 (td, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1.5 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 13.37 (br s, 1H).
10-043		nBu	1.02 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40-1.58 (m, 6H), 1.67-1.85 (m, 6H), 2.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.18 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 7.25-7.32 (m, 1H), 7.47-7.55 (m, 1H), 7.80 (dt, <i>J</i> = 9.6 Hz, 2.4 Hz, 1H), 7.89 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 13.84 (br s, 1H).
10-044		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.39-1.62 (m, 6H), 1.65-1.89 (m, 6H), 2.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.17 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.20 (t, <i>J</i> = 9.0 Hz, 2H), 8.11-8.16 (m, 2H), 8.42 (s, 1H), 13.79 (br s, 1H).

表 5 2



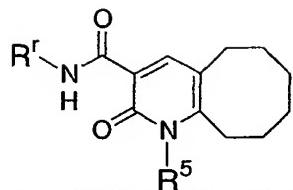
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-045		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.54 (m, 6H), 1.62-1.83 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.96 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.34-7.44 (m, 1H), 8.29 (s, 1H), 13.18 (br s, 1H).
10-046		nBu	1.02 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.39-1.56 (m, 6H), 1.67-1.85 (m, 6H), 2.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.17 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 7.32 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1.2 Hz, 1H), 7.86-8.01 (m, 2H), 8.41 (s, 1H), 13.88 (br s, 1H).
10-047		nBu	1.02 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.42-1.57 (m, 6H), 1.63-1.82 (m, 6H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.95 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.25 (s, 1H), 13.37 (br s, 1H).
10-048		nBu	1.03 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.55 (m, 6H), 1.68-1.87 (m, 6H), 2.70 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.96 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.20 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.57 (s, 2H), 14.30 (br s, 1H).
10-049		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.01-1.34 (m, 6H), 1.18 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.37-1.57 (m, 8H), 1.62-1.88 (m, 9H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.99-4.10 (m, 2H), 4.05-4.21 (m, 1H), 8.30 (s, 1H), 9.88 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H).
10-050		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.01-1.32 (m, 6H), 1.18 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H), 1.34-1.52 (m, 8H), 1.62-1.86 (m, 9H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.01-4.11 (m, 2H), 4.05-4.22 (m, 1H), 8.30 (s, 1H), 9.88 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).
10-051		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.55 (m, 4H), 1.48 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.65-1.82 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.97 (d, <i>J</i> = 4.2 Hz, 2H), 7.47-7.63 (m, 3H), 8.02-8.06 (m, 2H), 8.31 (s, 1H), 10.81 (br s, 1H).
10-052		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 3H), 1.28-1.55 (m, 12H), 1.59-1.80 (m, 10H), 1.99 (br s, 1H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.47 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 10.27 (br s, 1H).

表 5 3



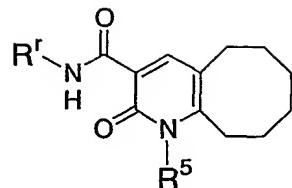
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-053		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.80 (m, 14H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.00 (br s, 4H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.94 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.63 (br s, 1H), 8.31 (s, 1H), 9.97 (br s, 1H).
10-054		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.35-1.79 (m, 10H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.79 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.13 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 5.52-5.59 (m, 1H), 7.26-7.45 (m, 5H), 8.32 (br s, 1H), 10.80 (br s, 1H).
10-055		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.79 (m, 10H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.03 (dd, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2.4 Hz, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.47 (q, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 7.31-7.50 (m, 5H), 8.28 (s, 1H), 10.82 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-056		nBu	0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.79 (m, 12H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.04, 3.21 (ABx, <i>J</i> = 16.2 Hz, 3.0 Hz, 2H), 4.07 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.74-4.80 (m, 1H), 5.56 (dd, <i>J</i> = 7.2 Hz, 5.1 Hz, 1H), 7.20-7.30 (m, 3H), 7.34-7.39 (m, 1H), 8.35 (s, 1H), 10.43 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-057		nBu	0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.81 (m, 12H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.04, 3.21 (ABx, <i>J</i> = 16.2 Hz, 3.0 Hz, 2H), 4.07 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.77 (sextet, <i>J</i> = 3.0 Hz, 1H), 5.56 (dd, <i>J</i> = 7.2 Hz, 5.1 Hz, 1H), 7.23-7.32 (m, 3H), 7.35-7.39 (m, 1H), 8.35 (s, 1H), 10.44 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-058		nBu	0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.53 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.64-1.79 (m, 6H), 1.85-1.98 (m, 2H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.08 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.18-7.40 (m, 5H), 8.27 (s, 1H), 10.40 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).

表 5 4



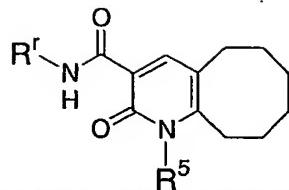
化合物 No.	$\text{R}^r$	$\text{R}^5$	$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ )
10-059		nBu	0.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.35-1.52 (m, 4H), 1.46 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.61-1.79 (m, 6H), 1.84-1.98 (m, 2H), 2.61 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.88 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.10 (br t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 5.08 (q, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.18-7.40 (m, 5H), 8.27 (s, 1H), 10.40 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H).
10-060		nBu	0.96 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.35-1.56 (m, 4H), 1.42 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.59-1.80 (m, 6H), 2.67 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.90 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.04 (s, 3H), 3.28-3.43 (m, 2H), 3.97-4.09 (m, 2H), 5.58 (td, $J = 4.5$ Hz, 1.5 Hz, 1H), 5.90 (dd, $J = 7.5$ Hz, 4.5 Hz, 1H), 7.18-7.35 (m, 4H), 8.35 (s, 1H), 10.64 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H).
10-061		nBu	0.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.35-1.56 (m, 4H), 1.42 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.61-1.81 (m, 6H), 2.67 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.90 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.04 (s, 3H), 3.28-3.44 (m, 2H), 3.92-4.09 (m, 2H), 5.58 (td, $J = 4.5$ Hz, 1.5 Hz, 1H), 5.90 (dd, $J = 7.5$ Hz, 4.5 Hz, 1H), 7.20-7.35 (m, 4H), 8.35 (s, 1H), 10.64 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H).
10-062		nBu	0.97 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.36-1.54 (m, 6H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.66 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.90 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.95, 3.34 (ABx, $J = 7.8$ Hz, 2H), 3.98-4.10 (m, 2H), 4.23 (q, $J = 7.2$ Hz, 1H), 5.65 (t, $J = 7.2$ Hz, 1H), 7.19-7.32 (m, 4H), 8.39 (s, 1H), 10.36 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H).
10-063		nBu	0.97 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.36-1.54 (m, 6H), 1.61-1.81 (m, 6H), 2.66 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.90 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.95, 3.34 (ABx, $J = 7.5$ Hz, 2H), 3.98-4.10 (m, 2H), 4.23 (q, $J = 7.2$ Hz, 1H), 5.65 (t, $J = 7.2$ Hz, 1H), 7.19-7.32 (m, 4H), 8.39 (s, 1H), 10.36 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H).
10-064		nBu	0.99 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.36-1.52 (m, 6H), 1.63-1.80 (m, 6H), 1.99 (br s, 1H), 2.62 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.88 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.36 (s, 3H), 3.45, 3.58 (ABx, $J = 5.4$ Hz, 4.2 Hz, 2H), 4.02-4.21 (m, 2H), 4.33-4.41 (m, 1H), 5.03 (d, $J = 5.1$ Hz, 1H), 7.26-7.35 (m, 3H), 7.42-7.46 (m, 2H), 8.25 (s, 1H), 10.62 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H).

表 5 5



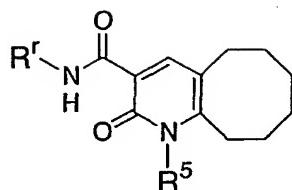
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-065		Bu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.35-1.53 (m, 6H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.31, 3.57 (ABx, <i>J</i> = 5.4 Hz, 4.2 Hz, 2H), 3.34 (s, 3H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.76-4.85 (m, 1H), 5.36 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.26-7.35 (m, 3H), 7.45-7.49 (m, 2H), 8.24 (s, 1H), 10.53 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-066		Bu	0.95 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H × 2), 0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.79 (m, 16H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.92-4.05 (m, 1H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 9.76 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-067		Bu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.34-1.51 (m, 6H), 1.61-1.79 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.31, (s, 3H), 3.79-3.90 (m, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.87-5.94 (m, 1H), 7.45-7.62 (m, 3H), 8.05-8.09 (m, 2H), 8.26 (s, 1H), 10.80 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-068		Me-O-CH <sub>2</sub> -	1.35 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.48 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.58 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.61-1.75 (m, 4H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.04 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.70 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 4.26-4.42 (m, 2H), 5.31 (quint, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.22-7.44 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.29 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-069		Me-O-CH <sub>2</sub> -	0.98-1.54 (m, 8H), 1.18 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H), 1.61-1.85 (m, 11H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.04 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.70 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.00-4.14 (m, 1H), 4.25-4.43 (m, 2H), 8.33 (s, 1H), 9.81 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H).
10-070		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34-1.53 (m, 6H), 1.63-1.80 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.83 (s, 3H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.22, 3.50 (ABx, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 3.32 (s, 3H), 4.02-4.21 (m, 2H), 4.68-4.78 (m, 1H), 5.86 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 7.32-7.49 (m, 5H), 8.23 (s, 1H), 10.50 (d, <i>J</i> = 9.6 Hz, 1H).

表 5 6



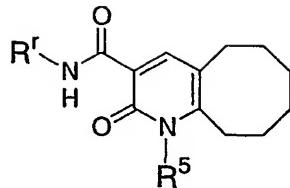
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-071		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.33-1.50 (m, 6H), 1.62-1.79 (m, 6H), 2.60 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.86 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.38, 3.68 (ABx, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 3.36 (s, 3H), 4.01-4.19 (m, 2H), 4.60-4.69 (m, 1H), 5.01 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.28-7.45 (m, 5H), 8.20 (s, 1H), 10.25 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-072		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.35-1.52 (m, 6H), 1.62-1.80 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.77, 3.87 (ABx, <i>J</i> = 6.6 Hz, 4.8 Hz, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.25 (quint, <i>J</i> = 4.8 Hz, 1H), 5.07 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 7.26-7.36 (m, 3H), 7.44-7.48 (m, 2H), 8.27 (s, 1H), 10.70 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H).
10-073		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.54 (m, 6H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.77, 3.87 (ABx, <i>J</i> = 6.6 Hz, 4.5 Hz, 2H), 4.08-4.16 (m, 2H), 4.25 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 5.07 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.23-7.36 (m, 3H), 7.44-7.49 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.70 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H).
10-074		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.32-1.54 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.78 (m, 6H), 2.57 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.86 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.03-4.22 (m, 2H), 4.12, 5.32 (ABx, <i>J</i> = 12.0 Hz, 1.5 Hz, 2H), 4.60 (dd, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1.5 Hz, 1H), 6.32 (d, <i>J</i> = 1.5 Hz, 1H), 7.24-7.32 (m, 3H), 7.38-7.42 (m, 2H), 8.09 (s, 1H), 10.97 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H).
10-075		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.56 (m, 4H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.79 (m, 6H), 2.57 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.86 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.02-4.23 (m, 2H), 4.12, 5.32 (ABx, <i>J</i> = 9.9 Hz, 1.5 Hz, 2H), 4.56-4.63 (m, 1H), 6.32 (d, <i>J</i> = 1.8 Hz, 1H), 7.24-7.32 (m, 3H), 7.38-7.42 (m, 2H), 8.09 (s, 1H), 10.97 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H).

表 5 7



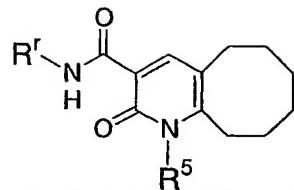
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-076		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 4H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63-1.79 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.55, 3.77 (ABx, <i>J</i> = 6.0 Hz, 5.1 Hz, 2H), 3.73 (br s, 1H), 4.03-4.19 (m, 2H), 4.43-4.52 (m, 1H), 5.10 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 7.26-7.37 (m, 3H), 7.46-7.50 (m, 2H), 8.25 (s, 1H), 10.67 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-077		nBu	0.05 (s, 3H), 0.06 (s, 3H), 0.93 (s, 9H), 0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.33-1.51 (m, 6H), 1.62-1.79 (m, 6H), 1.90 (br s, 1H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.73, 3.82 (ABx, <i>J</i> = 6.0 Hz, 4.5 Hz, 2H), 4.01-4.19 (m, 2H), 4.26 (sextet, <i>J</i> = 4.5 Hz, 1H), 5.10 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.24-7.33 (m, 3H), 7.43-7.48 (m, 2H), 8.22 (s, 1H), 10.71 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-078		nBu	0.05 (s, 3H), 0.06 (s, 3H), 0.93 (s, 9H), 0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.33-1.50 (m, 6H), 1.62-1.79 (m, 6H), 2.05 (br s, 1H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.73, 3.82 (ABx, <i>J</i> = 6.0 Hz, 4.5 Hz, 2H), 4.02-4.20 (m, 2H), 4.27 (sextet, <i>J</i> = 4.5 Hz, 1H), 5.10 (d, <i>J</i> = 4.8 Hz, 1H), 7.22-7.34 (m, 3H), 7.44-7.47 (m, 2H), 8.22 (s, 1H), 10.72 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-079		nBu	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.52 (m, 6H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.03 (s, 3H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.06, 3.40 (ABx, <i>J</i> = 9.0 Hz, 7.2 Hz, 2H), 3.74 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 3.99-4.21 (m, 2H), 5.46 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 7.22-7.29 (m, 3H), 7.33-7.38 (m, 1H), 8.33 (s, 1H), 10.60 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H).
10-080		nBu	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.54 (m, 6H), 1.61-1.78 (m, 6H), 2.01 (s, 3H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.11, 3.41 (ABx, <i>J</i> = 9.0 Hz, 7.5 Hz, 2H), 3.76 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 3.99-4.23 (m, 2H), 5.48 (t, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 7.21-7.30 (m, 3H), 7.34-7.38 (m, 1H), 8.32 (s, 1H), 10.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 5 8



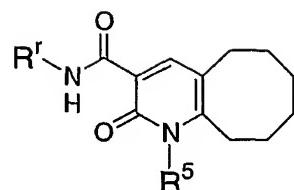
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-081		nBu	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.57 (m, 6H), 1.62-1.81 (m, 6H), 2.02 (s, 3H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71, 3.68 (ABx, <i>J</i> = 15.6 Hz, 7.8 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.92-4.07 (m, 1H), 4.11-4.27 (m, 2H), 5.60 (t, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H), 7.21-7.35 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.66 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-082		nBu	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.58 (m, 6H), 1.66-1.82 (m, 6H), 2.02 (s, 3H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71, 3.68 (ABx, <i>J</i> = 15.6 Hz, 7.8 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.92-4.06 (m, 1H), 4.12-4.28 (m, 2H), 5.60 (t, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H), 7.20-7.34 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.66 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-083		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.17 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 6H), 1.37-1.56 (m, 4H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63-1.80 (m, 6H), 2.43 (quint, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.70, 3.71 (ABx, <i>J</i> = 15.6 Hz, 7.8 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.98-4.06 (m, 1H), 4.13-4.21 (m, 2H), 5.60 (t, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H), 7.22-7.37 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.65 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-084		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 6H), 1.62-1.80 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.94, 4.14 (ABx, <i>J</i> = 12.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.08-4.18 (m, 2H), 5.76-5.82 (m, 1H), 7.47-7.53 (m, 2H), 7.57-7.63 (m, 1H), 8.08-8.11 (m, 2H), 8.29 (s, 1H), 11.13 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H).
10-085		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.56 (m, 6H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.94, 4.14 (ABx, <i>J</i> = 12.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.08-4.18 (m, 2H), 5.77-5.83 (m, 1H), 7.48-7.53 (m, 2H), 7.57-7.65 (m, 1H), 8.08-8.12 (m, 2H), 8.30 (s, 1H), 11.14 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H).
10-086		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.53 (m, 6H), 1.65-1.81 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.89, 4.11 (ABx, <i>J</i> = 11.4 Hz, 5.1 Hz, 2H), 4.08-4.19 (m, 2H), 6.01-6.08 (m, 1H), 7.45-7.53 (m, 2H), 7.57-7.63 (m, 1H), 8.04-8.08 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.92 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).

表 5 9



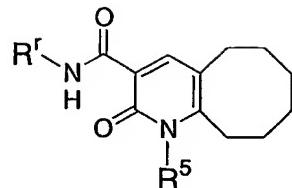
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-087		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.51 (m, 6H), 1.62-1.79 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.90, 4.11 (ABx, <i>J</i> = 11.4 Hz, 5.1 Hz, 2H), 4.08-4.19 (m, 2H), 6.00-6.08 (m, 1H), 7.45-7.53 (m, 2H), 7.56-7.63 (m, 1H), 8.03-8.07 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.92 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-088		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.54 (m, 6H), 1.64-1.80 (m, 6H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.17 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.58 (s, 1H), 7.10 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H), 7.53-7.59 (m, 1H), 7.77-7.82 (m, 2H), 8.31 (s, 1H), 12.52 (br s, 1H).
10-089		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.55 (m, 6H), 1.60-1.81 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.91 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.51-5.58 (m, 1H), 7.27-7.48 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.77 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-090		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H × 2/5), 0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H × 3/5), 1.36-1.79 (m, 12H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H × 2/5), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H × 3/5), 2.87 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H × 2/5), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H × 3/5), 3.52, 4.15 (ABx, <i>J</i> = 11.1 Hz, 4.2 Hz, 2H), 4.10-4.20 (m, 2H), 4.83-4.91 (m, 1H × 3/5), 4.98-5.08 (m, 1H × 2/5), 5.30 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H × 2/5), 5.44 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H × 3/5), 7.28-7.38 (m, 3H), 7.46-7.53 (m, 2H), 8.16 (s, 1H × 2/5), 8.23 (s, 1H × 3/5), 10.46 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H × 2/5), 10.72 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H × 3/5).
10-091		nBu	-0.12 (s, 3H), -0.11 (s, 3H), 0.74 (s, 9H), 0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.53 (m, 6H), 1.62-1.78 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.96-4.10 (m, 2H), 4.11-4.22 (m, 2H), 5.80-5.88 (m, 1H), 7.43-7.49 (m, 2H), 7.53-7.61 (m, 1H), 8.05-8.09 (m, 2H), 8.26 (s, 1H), 10.81 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).

表 6 0



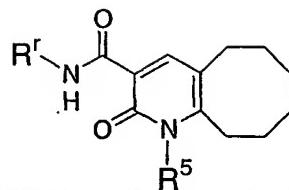
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-092		nBu	-0.12 (s, 3H), -0.11 (s, 3H), 0.74 (s, 9H), 0.98 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.52 (m, 6H), 1.62-1.78 (m, 6H), 2.62 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.96-4.10 (m, 2H), 4.10-4.23 (m, 2H), 5.80-5.87 (m, 1H), 7.43-7.49 (m, 2H), 7.53-7.61 (m, 1H), 8.05-8.09 (m, 2H), 8.26 (s, 1H), 10.80 (d, J = 7.5 Hz, 1H).
10-093		nBu	0.99 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.52 (m, 6H), 1.63-1.81 (m, 6H), 2.63 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.56, 3.77 (ABx, J = 11.1 Hz, 5.1 Hz, 2H), 4.08-4.18 (m, 2H), 4.44-4.53 (m, 1H), 5.10 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.25-7.37 (m, 3H), 7.46-7.49 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.69 (d, J = 7.8 Hz, 1H).
10-094		nBu	1.00 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 6H), 1.63-1.80 (m, 6H), 2.63 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.11 (br t, J = 7.2 Hz, 2H), 4.34-4.42 (m, 1H), 4.48-4.57 (m, 2H), 5.03 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 7.26-7.37 (m, 3H), 7.41-7.46 (m, 2H), 8.26 (s, 1H), 10.62 (d, J = 7.5 Hz, 1H).
10-095		nBu	0.99 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 6H), 1.62-1.79 (m, 6H), 2.63 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.11 (br t, J = 7.2 Hz, 2H), 4.34-4.42 (m, 1H), 4.48-4.57 (m, 2H), 5.03 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 7.26-7.37 (m, 3H), 7.41-7.46 (m, 2H), 8.24 (s, 1H), 10.60 (d, J = 7.5 Hz, 1H).
10-096		nBu	0.99 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.51 (m, 6H), 1.64-1.78 (m, 6H), 2.65 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (br t, J = 7.2 Hz, 2H), 4.93 (d, J = 4.5 Hz, 2H), 7.14-7.21 (m, 2H), 8.04-8.10 (m, 2H), 8.30 (s, 1H), 10.79 (br s, 1H).
10-097		nBu	0.98 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.50 (m, 6H), 1.62-1.78 (m, 6H), 2.59 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.86 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.76, 4.15 (ABx, J = 11.7 Hz, 4.5 Hz, 2H), 4.00-4.13 (m, 2H), 4.98-5.07 (m, 1H), 5.80 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.24-7.37 (m, 3H), 7.49-7.53 (m, 2H), 8.16 (s, 1H), 10.46 (d, J = 8.7 Hz, 1H).

表 6 1



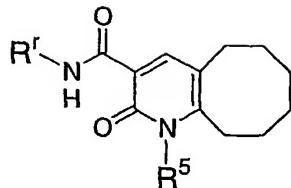
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-098		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 6H), 1.63-1.81 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.47, 3.65 (ABx, <i>J</i> = 11.1 Hz, 5.1 Hz, 2H), 4.08-4.19 (m, 2H), 4.83-4.92 (m, 1H), 6.28 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 7.29-7.39 (m, 3H), 7.44-7.53 (m, 2H), 8.17 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 10.64 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H).
10-099		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 6H), 1.62-1.79 (m, 6H), 2.59 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.86 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.76, 4.15 (ABx, <i>J</i> = 11.4 Hz, 4.5 Hz, 2H), 3.99-4.13 (m, 2H), 4.98-5.07 (m, 1H), 5.30 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.24-7.41 (m, 3H), 7.50-7.53 (m, 2H), 8.16 (s, 1H), 10.46 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).
10-100		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.53 (m, 6H), 1.64-1.80 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.47, 3.65 (ABx, <i>J</i> = 11.1 Hz, 5.1 Hz, 2H), 4.08-4.18 (m, 2H), 4.83-4.92 (m, 1H), 6.28 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 7.30-7.38 (m, 3H), 7.45-7.49 (m, 2H), 8.17 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 10.64 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H).
10-101			1.21-1.52 (m, 8H), 1.59-1.79 (m, 8H), 1.94-1.99 (m, 2H), 2.09 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.78 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.93-4.03 (m, 1H), 4.05 (dd, <i>J</i> = 6.6 Hz, 2.1 Hz, 1H), 4.20 (dd, <i>J</i> = 14.1 Hz, 2.1 Hz, 1H), 4.25 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.49 (dd, <i>J</i> = 14.4 Hz, 6.9 Hz, 1H), 8.31 (s, 1H), 9.85 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-102			1.30-1.54 (m, 8H), 1.60-1.78 (m, 8H), 1.87-2.00 (m, 4H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.53 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.91-4.02 (m, 1H), 4.34 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.37 (s, 1H), 9.77 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-103		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.39-1.55 (m, 4H), 1.49 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.68-1.83 (m, 6H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.18 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.21 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.55 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.64 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 12.41 (br s, 1H).

表 6 2



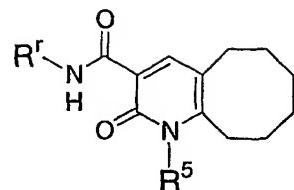
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-104		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 6H), 1.63-1.80 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.88 (s, 3H), 4.14 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.91 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 6.97 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 8.03 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 10.80 (br s, 1H).
10-105		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.53 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.63-1.80 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.91 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 7.64 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 7.90 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 8.29 (s, 1H), 10.79 (br s, 1H).
10-106		Me-O-CH <sub>2</sub> -	1.30-1.53 (m, 8H), 1.58-1.79 (m, 8H), 1.96-2.02 (m, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.03 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.69 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 3.92-4.03 (m, 1H), 4.33 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 8.32 (s, 1H), 9.83 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-107		Me-O-CH <sub>2</sub> -	1.35-1.42 (m, 2H), 1.43-1.52 (m, 2H), 1.62-1.79 (m, 4H), 2.70 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.06 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.74 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 4.40 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 4.97 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 7.50 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.61 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.05 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.33 (s, 1H), 10.75 (br s, 1H).
10-108		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 6H), 1.63-1.79 (m, 8H), 1.95-2.07 (m, 2H), 2.20-2.33 (m, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.82-2.94 (m, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.55 (br s, 2H), 3.96-4.07 (m, 1H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 7.23-7.40 (m, 5H), 8.27 (s, 1H), 9.97 (br s, 1H).
10-109		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.50 (m, 6H), 1.63-1.79 (m, 6H), 1.81-1.97 (m, 2H), 2.04 (s, 3H), 2.15-2.24 (m, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.01 (t, <i>J</i> = 10.2 Hz, 2H), 3.33-3.41 (m, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.10-4.25 (m, 1H), 8.26 (s, 1H), 10.21 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).

表 6 3



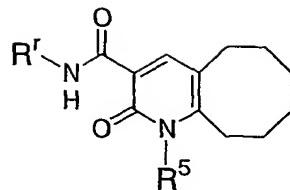
化合物 No.	R¹	R⁵	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-110		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.58 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.62-1.79 (m, 8H), 1.97-2.11 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92-3.02 (m, 1H), 3.21-3.31 (m, 1H), 3.75-3.81 (m, 1H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.11-4.23 (m, 1H), 4.37-4.43 (m, 1H), 8.29 (s, 1H), 10.08 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-111		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.57 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.62-1.79 (m, 8H), 1.93-2.15 (m, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.11-3.27 (m, 2H), 3.69-3.79 (m, 1H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.19-4.30 (m, 1H), 4.50-4.60 (m, 1H), 7.41 (s, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.12 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-112		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.29 (s, 9H), 1.35-1.79 (m, 14H), 2.00-2.09 (m, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.09 (t, <i>J</i> = 11.4 Hz, 2H), 4.06-4.35 (m, 5H), 8.30 (s, 1H), 10.06 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-113		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.28-1.81 (m, 24H), 1.98-2.10 (m, 2H), 2.44-2.53 (m, 1H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89-2.99 (m, 1H), 3.15-3.28 (m, 1H), 3.85-3.93 (m, 1H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.10-4.25 (m, 1H), 4.40-4.48 (m, 1H), 8.30 (s, 1H), 10.06 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
10-114		nBu	1.02 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.78 (m, 14H), 2.07-2.20 (m, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.81 (s, 3H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94-3.01 (m, 2H), 3.70-3.79 (m, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.11-4.23 (m, 1H), 8.29 (s, 1H), 10.11 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-115		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.51 (m, 6H), 1.62-1.78 (m, 8H), 2.03-2.09 (m, 2H), 2.53 (td, <i>J</i> = 11.4 Hz, 2.4 Hz, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.71-3.77 (m, 2H), 3.82-3.94 (m, 1H), 4.07 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.52-7.65 (m, 3H), 7.76-7.71 (m, 2H), 8.25 (s, 1H), 10.00 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).

表 6 4



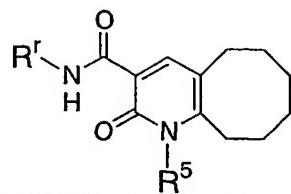
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-116		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 4H), 1.47 (quint, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.64-1.82 (m, 8H), 2.01-2.09 (m, 2H), 2.25-2.34 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.82-2.90 (m, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.97-4.06 (m, 1H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.28 (s, 1H), 9.98 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-117		Cl	1.21-1.53 (m, 8H), 1.62-1.82 (m, 8H), 1.95-2.00 (m, 2H), 2.20 (dt, <i>J</i> = 15.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.92-4.02 (m, 1H), 4.28 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.33 (s, 1H), 9.80 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
10-118			1.26-1.52 (m, 8H), 1.60-1.80 (m, 8H), 1.94-2.00 (m, 2H), 2.19 (quint, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.06 (s, 3H), 3.92-4.01 (m, 1H), 4.27 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.38 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 8.33 (s, 1H), 9.78 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-119			1.25-1.52 (m, 8H), 1.59-1.79 (m, 8H), 1.93-2.05 (m, 4H), 2.32 (s, 3H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.98 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 3.91-4.01 (m, 1H), 4.15 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 9.82 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-120			1.25-1.52 (m, 8H), 1.58-1.80 (m, 8H), 1.93-2.03 (m, 4H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.48 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.92-4.03 (m, 1H), 4.20 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.32 (s, 1H), 9.81 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
10-121			1.27-1.53 (m, 8H), 1.60-1.81 (m, 8H), 1.92-2.01 (m, 2H), 2.05 (s, 3H), 2.20-2.29 (m, 2H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.98 (br s, 2H), 3.90-4.00 (m, 1H), 4.27-4.35 (m, 2H), 8.40 (s, 1H), 9.50 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-122			1.24-1.52 (m, 8H), 1.62-1.79 (m, 8H), 1.88-2.03 (m, 4H), 2.03 (s, 3H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.24-3.30 (m, 2H), 3.97-4.05 (m, 1H), 4.22 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.72 (br s, 1H), 8.35 (s, 1H), 9.81 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).

表 6 5



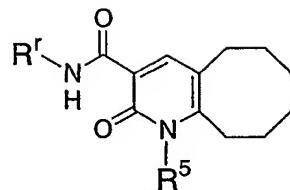
化合物 No.	R <sup>x</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-123		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.52 (m, 6H), 1.60-1.72 (m, 6H), 1.71-1.80 (m, 2H), 2.07-2.17 (m, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.17 (t, <i>J</i> = 11.1 Hz, 1H), 3.37 (t, <i>J</i> = 11.1 Hz, 1H), 3.92-3.99 (m, 1H), 4.03-4.12 (m, 2H), 4.22-4.37 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.17 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-124		BzHN-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	1.29-1.51 (m, 8H), 1.65-1.77 (m, 8H), 1.92-2.05 (m, 4H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.45 (br s, 2H), 3.97-4.05 (m, 1H), 4.32 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.42-7.55 (m, 3H), 7.89 (br s, 1H), 7.90-7.96 (m, 2H), 8.37 (s, 1H), 9.90 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-125			1.25 (s, 9H), 1.28-1.51 (m, 8H), 1.60-1.78 (m, 8H), 1.85-2.00 (m, 4H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.23 (br s, 2H), 3.95-4.04 (m, 1H), 4.22 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.12 (br s, 1H), 8.35 (s, 1H), 9.89 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-126			1.27-1.52 (m, 8H), 1.57-1.80 (m, 14H), 1.83-2.01 (m, 6H), 2.55-2.65 (m, 1H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.25-3.29 (m, 2H), 3.95-4.04 (m, 1H), 4.22 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.73 (br s, 1H), 8.34 (s, 1H), 9.85 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-127			1.29-1.52 (m, 8H), 1.61-1.79 (m, 8H), 1.91-2.02 (m, 4H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.34 (br s, 2H), 3.97-4.04 (m, 1H), 4.27 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.39 (s, 1H), 8.67 (br s, 1H), 9.76 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-128		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.54 (m, 6H), 1.68-1.81 (m, 6H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.18 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 12.69 (br s, 1H).

表 6 6



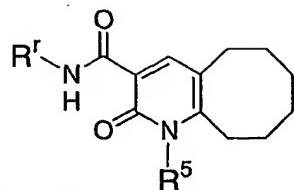
化合物 No.	$\text{R}^r$	$\text{R}^5$	$^1\text{H-NMR} (\text{CDCl}_3)$
10-129		nBu	1.00 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.37-1.54 (m, 6H), 1.65-1.81 (m, 6H), 2.67 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.92 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.17 (br t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 6.22 (s, 1H $\times$ 1/5), 6.39 (s, 1H $\times$ 1/5), 6.47 (s, 1H $\times$ 1/5), 6.64 (s, 1H $\times$ 1/5), 6.88 (s, 1H $\times$ 1/5), 7.01-7.10 (m, 1H), 7.18-7.27 (m, 2H), 8.36 (s, 1H), 8.60 (dd, $J = 7.8$ Hz, 1.8 Hz, 1H), 12.59 (br s, 1H).
10-130		nBu	1.00 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.37-1.53 (m, 4H), 1.47 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.65-1.82 (m, 6H), 2.67 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.92 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.18 (br t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.08 (td, $J = 8.4$ Hz, 1.8 Hz, 1H), 7.26-7.34 (m, 2H), 8.36 (s, 1H), 8.64 (dd, $J = 9.0$ Hz, 1.8 Hz, 1H), 12.76 (br s, 1H).
10-131		nBu	1.00 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.38-1.54 (m, 4H), 1.47 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.61-1.82 (m, 6H), 2.68 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.93 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.16 (br t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.41 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 13.49 (br s, 1H).
10-132		nBu	1.01 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 4H), 1.48 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.63-1.85 (m, 6H), 2.68 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.94 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.17 (br t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.27-7.32 (m, 1H), 7.36-7.42 (m, 2H), 7.57-7.61 (m, 2H), 7.71 (s, 1H), 8.37 (s, 1H), 13.52 (br s, 1H).
10-133		nBu	1.01 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.40-1.55 (m, 4H), 1.49 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.65-1.81 (m, 6H), 2.68 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.93 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.19 (br t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.38-7.52 (m, 4H), 7.78 (t, $J = 8.1$ Hz, 1H), 8.09 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 8.33 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 8.40 (s, 1H), 12.61 (br s, 1H).
10-134		$\text{MsHN}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	1.28-1.52 (m, 8H), 1.63-1.80 (m, 8H), 1.92-2.01 (m, 4H), 2.64 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.90 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.94 (s, 3H), 3.08 (q, $J = 5.4$ Hz, 2H), 3.94-4.02 (m, 1H), 4.29 (br t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 5.84 (br t, $J = 7.5$ Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 9.72 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H).

表 6 7



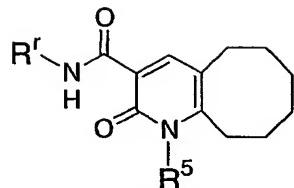
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>s</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-135			1.29-1.50 (m, 8H), 1.63-1.78 (m, 8H), 1.86-2.00 (m, 4H), 2.61 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.79-2.90 (m, 2H), 2.85 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.95-4.03 (m, 1H), 4.24 (br t, J = 7.5 Hz, 2H), 6.19 (br s, 1H), 7.44-7.58 (m, 3H), 7.82-7.87 (m, 2H), 8.34 (s, 1H), 9.75 (d, J = 7.5 Hz, 1H).
10-136		nBu	0.98 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.53 (m, 4H), 1.45 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.64-1.77 (m, 6H), 2.31 (s, 3H), 2.62 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.21, 3.66 (ABx, J = 13.8 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.10 (br t, J = 7.5 Hz, 2H), 5.92-6.00 (m, 1H), 7.46-7.52 (m, 2H), 7.55-7.62 (m, 1H), 8.12-8.16 (m, 2H), 8.27 (s, 1H), 10.76 (d, J = 8.4 Hz, 1H).
10-137		nBu	0.98 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.52 (m, 4H), 1.45 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.63-1.77 (m, 6H), 2.31 (s, 3H), 2.62 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.21, 3.66 (ABx, J = 13.8 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.11 (br t, J = 7.5 Hz, 2H), 5.92-6.00 (m, 1H), 7.46-7.62 (m, 3H), 8.12-8.16 (m, 2H), 8.27 (s, 1H), 10.75 (d, J = 7.8 Hz, 1H).
10-138		Me-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	1.01 (d, J = 6.9 Hz, 6H), 1.38-1.52 (m, 4H), 1.60-1.73 (m, 5H), 1.78 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 2.65 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.96 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, J = 7.5 Hz, 2H), 4.97 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 7.50 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.61 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 8.02-8.06 (m, 2H), 8.30 (s, 1H), 10.79 (br s, 1H).
10-139			1.05-1.38 (m, 6H), 1.50 (br s, 2H), 1.63-1.77 (m, 10H), 1.82-1.93 (m, 1H), 2.65 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.04 (br s, 2H), 4.97 (d, J = 4.5 Hz, 2H), 7.50 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.61 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 8.02-8.06 (m, 2H), 8.31 (s, 1H), 10.79 (br s, 1H).
10-140			1.31-1.51 (m, 10H), 1.57-1.79 (m, 14H), 1.94-2.01 (m, 2H), 2.50-2.66 (m, 8H), 3.90-4.01 (m, 1H), 4.28 (br t, J = 7.5 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 9.84 (d, J = 7.8 Hz, 1H).

表 6 8



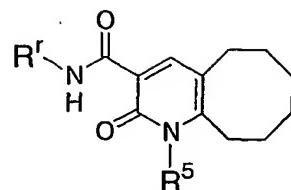
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-141	Bn-N(cyclohexyl)cyclohexyl	Me-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	1.01 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 6H), 1.34-1.53 (m, 4H), 1.56-1.80 (m, 9H), 1.97-2.05 (m, 2H), 2.17-2.27 (m, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.81-2.89 (m, 2H), 2.87 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.54 (s, 2H), 3.96-4.04 (m, 1H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.26-7.35 (m, 5H), 8.27 (s, 1H), 9.96 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-142	Bn-N(cyclohexyl)cyclohexyl	cyclohexyl-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	1.05-1.36 (m, 8H), 1.48 (br s, 2H), 1.64-1.88 (m, 11H), 1.96-2.05 (m, 2H), 2.22 (t, <i>J</i> = 9.9 Hz, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.81-2.86 (m, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.54 (s, 2H), 3.93-4.02 (m, 3H), 7.23-7.36 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 9.96 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-143	NH-cyclohexyl-CH <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> H	Me-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	1.02 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 6H), 1.36-1.73 (m, 8H), 1.77 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 4H), 1.98-2.10 (m, 1H), 2.05 (s, 3H), 2.21-2.30 (m, 2H), 2.61-2.68 (m, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.09 (t, <i>J</i> = 9.9 Hz, 2H), 3.42-3.50 (m, 2H), 4.05-4.21 (m, 3H), 8.25 (s, 1H), 10.27 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H).
10-144	Ac-N(cyclohexyl)cyclohexyl	Me-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	1.01 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 6H), 1.36-1.72 (m, 9H), 1.76 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 4H), 1.99-2.10 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91-3.00 (m, 1H), 3.21-3.03 (m, 1H), 3.76-3.81 (m, 1H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.11-4.25 (m, 1H), 4.36-4.44 (m, 1H), 8.28 (s, 1H), 10.07 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-145	Ms-N(cyclohexyl)cyclohexyl	Me-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	1.01 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 6H), 1.37-1.80 (m, 13H), 2.08-2.16 (m, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.81 (s, 3H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89-2.99 (m, 2H), 3.68-3.76 (m, 2H), 4.05-4.16 (m, 3H), 8.27 (s, 1H), 10.10 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-146	F <sub>3</sub> C-C(=O)-N(cyclohexyl)cyclohexyl	Me-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	1.01 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 6H), 1.38-1.78 (m, 13H), 2.08-2.15 (m, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.11-3.21 (m, 1H), 3.31-3.41 (m, 1H), 3.96 (t, <i>J</i> = 14.4 Hz, 1H), 4.14 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.21-4.38 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.16 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).

表 6 9



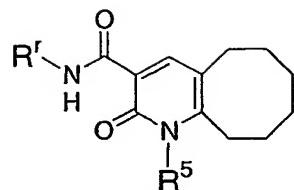
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-147			1.06-1.40 (m, 8H), 1.49 (br s, 2H), 1.61-1.99 (m, 11H), 2.18-2.28 (m, 2H), 2.64 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.04 (t, J = 10.5 Hz, 2H), 3.38-3.44 (m, 2H), 4.05-4.20 (m, 3H), 8.26 (s, 1H), 10.23 (d, J = 7.2 Hz, 1H).
10-148			1.02-1.33 (m, 8H), 1.45-1.80 (m, 13H), 1.98-2.10 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.65 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.93-3.01 (m, 1H), 3.21-3.31 (m, 1H), 3.74-3.81 (m, 1H), 3.99 (br s, 1H), 4.10-4.23 (m, 2H), 4.37-4.43 (m, 1H), 8.29 (s, 1H), 10.08 (d, J = 7.8 Hz, 1H).
10-149			1.02-1.33 (m, 8H), 1.49 (br s, 2H), 1.60-1.81 (m, 11H), 2.08-2.15 (m, 2H), 2.65 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.81 (s, 3H), 2.90-3.00 (m, 4H), 3.69-3.76 (m, 2H), 3.99 (br s, 1H), 4.06-4.12 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.10 (d, J = 7.2 Hz, 1H).
10-150			1.03-1.38 (m, 8H), 1.49 (br s, 2H), 1.60-1.85 (m, 11H), 2.07-2.17 (m, 2H), 2.65 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.11-3.21 (m, 1H), 3.31-3.41 (m, 1H), 3.96 (d, J = 14.4 Hz, 2H), 4.00 (br s, 1H), 4.22-4.38 (m, 2H), 8.29 (s, 1H), 10.17 (d, J = 7.5 Hz, 1H).
10-151		nBu	1.00 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.54 (m, 4H), 1.47 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 1.66-1.83 (m, 6H), 2.49 (s, 3H), 2.67 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, J = 7.2 Hz, 2H), 6.87 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.59 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 8.15 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 12.55 (br s, 1H).
10-152		nBu	0.99 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.54 (m, 4H), 1.46 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 1.66-1.83 (m, 6H), 2.67 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 6.99-7.04 (m, 1H), 7.67-7.74 (m, 1H), 8.33-8.37 (m, 2H), 8.36 (s, 1H), 12.77 (br s, 1H).
10-153		Me-O-CH <sub>2</sub> -	1.36-1.43 (m, 2H), 1.47-1.55 (m, 2H), 1.65-1.80 (m, 4H), 2.69 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.08 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.74 (t, J = 5.1 Hz, 2H), 4.39 (t, J = 5.1 Hz, 2H), 7.18 (dd, J = 7.5 Hz, 0.9 Hz, 1H), 7.54 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 8.33 (dd, J = 8.1 Hz, 0.9 Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 12.62 (br s, 1H).

表 7 0



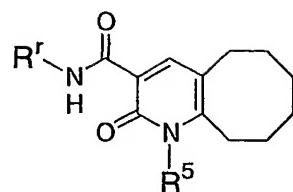
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-154			1.38-1.83 (m, 14H), 2.52-2.73 (m, 6H), 2.67 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.02 (br t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.39 (br t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.19 (dd, J = 7.5 Hz, 0.6 Hz, 1H), 7.54 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 8.33 (dd, J = 8.4 Hz, 0.6 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 12.58 (br s, 1H).
10-155			1.37-1.55 (m, 4H), 1.67-1.86 (m, 4H), 1.97 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 2.68 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.97 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.60 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 4.39 (br t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.20 (dd, J = 7.5 Hz, 0.6 Hz, 1H), 7.54 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 8.33 (dd, J = 8.1 Hz, 0.6 Hz, 1H), 8.40 (s, 1H), 12.45 (br s, 1H).
10-156			1.39-1.46 (m, 2H), 1.47-1.56 (m, 2H), 1.66-1.74 (m, 2H), 1.77-1.85 (m, 2H), 2.23 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 2.68 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.10 (s, 3H), 4.33 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 4.40 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 7.19 (dd, J = 7.5 Hz, 0.6 Hz, 1H), 7.55 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 8.32 (dd, J = 8.4 Hz, 0.6 Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 12.56 (br s, 1H).
10-157			1.37-1.45 (m, 2H), 1.47-1.56 (m, 2H), 1.66-1.74 (m, 2H), 1.76-1.85 (m, 2H), 2.03 (quint, J = 7.5 Hz, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.66 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.00 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 4.21 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.18 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.54 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 12.59 (br s, 1H).
10-158			1.38-1.45 (m, 2H), 1.47-1.56 (m, 2H), 1.66-1.74 (m, 2H), 1.77-1.86 (m, 2H), 1.97-2.07 (m, 2H), 2.68 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.95 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.52 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.25 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.19 (dd, J = 7.5 Hz, 0.6 Hz, 1H), 7.54 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 8.32 (dd, J = 8.4 Hz, 0.6 Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 12.58 (br s, 1H).

表 7 1



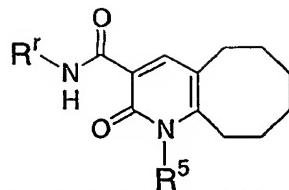
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-159		AcHN-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	1.38-1.44 (m, 2H), 1.47-1.56 (m, 2H), 1.65-1.74 (m, 2H), 1.76-1.84 (m, 2H), 1.94 (quint, J = 6.6 Hz, 2H), 2.10 (s, 3H), 2.68 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.30 (q, J = 6.0 Hz, 2H), 4.26 (br t, J = 7.5 Hz, 2H), 6.63 (br t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 8.1 Hz, 0.6 Hz, 1H), 7.56 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 8.34 (dd, J = 8.1 Hz, 0.6 Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 12.51 (br s, 1H).
10-160		MsHN-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	1.41-1.85 (m, 8H), 2.01-2.11 (m, 2H), 2.68 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.04 (s, 3H), 3.18 (q, J = 6.0 Hz, 2H), 4.34 (br t, J = 7.5 Hz, 2H), 5.58 (br t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.20 (dd, J = 7.5 Hz, 0.6 Hz, 1H), 7.55 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 8.31 (dd, J = 8.1 Hz, 0.6 Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 12.45 (br s, 1H).
10-161		F <sub>3</sub> C-C(=O)-N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	1.42-1.83 (m, 8H), 2.03 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 2.69 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.41 (q, J = 6.0 Hz, 2H), 4.30 (br t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.22 (dd, J = 7.8 Hz, 0.6 Hz, 1H), 7.56 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 8.13 (br s, 1H), 8.31 (dd, J = 7.8 Hz, 0.6 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 12.40 (br s, 1H).
10-162		nBu	0.99 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.39-1.57 (m, 4H), 1.47 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 1.65-1.83 (m, 6H), 2.51 (s, 3H), 2.68 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, J = 7.2 Hz, 2H), 6.86 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.54 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 12.91 (br s, 1H).
10-163		nBu	0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.39-1.53 (m, 4H), 1.46 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.65-1.82 (m, 6H), 2.47 (s, 6H), 2.67 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (br t, J = 7.5 Hz, 2H), 6.74 (s 1H), 8.41 (s, 1H), 12.75 (br s, 1H).
10-164		OHC-CH <sub>2</sub> -	1.22-1.52 (m, 8H), 1.63-1.79 (m, 8H), 1.92-2.00 (m, 2H), 2.64 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.96 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 3.92-4.03 (m, 1H), 4.42 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 8.32 (s, 1H), 9.75 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 9.84 (s, 1H).

表 7 2



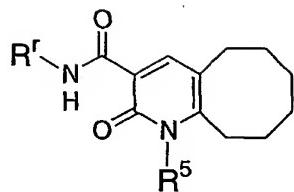
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-165			1.20 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H), 1.21-1.87 (m, 18H), 1.90-2.01 (m, 2H), 2.55-2.73 (m, 2H), 2.85-3.02 (m, 2H), 3.62-3.70 (m, 1H), 3.92-4.01 (m, 2H), 4.65-4.78 (m, 1H), 8.36 (s, 1H), 9.77 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-166			1.23-1.51 (m, 8H), 1.58-1.78 (m, 8H), 1.94-2.00 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.92-4.01 (m, 1H), 4.36 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 9.78 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-167			1.38-1.43 (m, 2H), 1.44-1.52 (m, 2H), 1.65-1.83 (m, 4H), 1.86-1.95 (m, 2H), 1.91-2.05 (m, 1H), 2.63-2.74 (m, 1H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.85-2.96 (m, 1H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.99-3.09 (m, 1H), 3.51 (br t, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 4.22-4.38 (m, 2H), 5.66 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.19-7.38 (m, 4H), 8.43 (s, 1H), 10.11 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
10-168			1.38-1.42 (m, 2H), 1.44-1.52 (m, 2H), 1.64-1.80 (m, 4H), 1.91-2.08 (m, 1H), 2.11-2.21 (m, 2H), 2.62-2.73 (m, 1H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.83-2.96 (m, 1H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.99-3.06 (m, 1H), 3.02 (s, 3H), 4.25 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 4.33 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 5.67 (q, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.16-7.26 (m, 3H), 7.35-7.39 (m, 1H), 8.39 (s, 1H), 10.13 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).
10-169			1.37-1.43 (m, 2H), 1.44-1.53 (m, 2H), 1.67-1.80 (m, 4H), 1.91-2.10 (m, 1H), 2.00-2.20 (m, 2H), 2.62-2.73 (m, 1H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.84-2.96 (m, 1H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.98-3.08 (m, 1H), 4.25 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.45 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 4.61 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.67 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.16-7.28 (m, 3H), 7.35-7.39 (m, 1H), 8.39 (s, 1H), 10.17 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H).

表 7 3



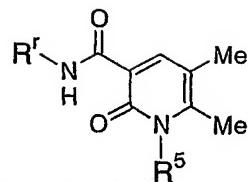
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-170		NCCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	1.38-1.43 (m, 2H), 1.44-1.54 (m, 2H), 1.67-1.82 (m, 4H), 1.91-2.06 (m, 1H), 2.06 (quint, J = 7.5 Hz, 2H), 2.49 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.62-2.74 (m, 1H), 2.67 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.85-2.96 (m, 1H), 2.91 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.99-3.09 (m, 1H), 4.21 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 5.67 (q, J = 7.5 Hz, 1H), 7.19-7.26 (m, 3H), 7.35-7.39 (m, 1H), 8.40 (s, 1H), 10.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H).
10-171		N <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	1.37-1.44 (m, 2H), 1.45-1.55 (m, 2H), 1.67-1.80 (m, 4H), 1.93-2.03 (m, 3H), 2.62-2.73 (m, 1H), 2.66 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.84-2.96 (m, 1H), 2.91 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.99-3.09 (m, 1H), 3.50 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 4.17 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 5.67 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 7.18-7.26 (m, 3H), 7.35-7.39 (m, 1H), 8.39 (s, 1H), 10.16 (d, J = 8.4 Hz, 1H).
10-172		AcHNCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	1.37-1.43 (m, 2H), 1.44-1.52 (m, 2H), 1.63-1.78 (m, 4H), 1.83-2.02 (m, 1H), 1.87 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 1.95 (s, 3H), 2.67 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.69-2.76 (m, 1H), 2.88-2.95 (m, 1H), 2.90 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.97-3.08 (m, 1H), 3.23 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 4.19 (br t, J = 7.5 Hz, 2H), 5.67 (q, J = 7.5 Hz, 1H), 6.65 (br t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.18-7.28 (m, 3H), 7.36-7.39 (m, 1H), 8.41 (s, 1H), 10.15 (d, J = 8.1 Hz, 1H).
10-173		MsHNCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	1.37-1.42 (m, 2H), 1.44-1.53 (m, 2H), 1.63-1.78 (m, 4H), 1.90-2.02 (m, 3H), 2.62-2.73 (m, 1H), 2.67 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.84 (s, 3H), 2.85-2.97 (m, 1H), 2.90 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.00-3.10 (m, 2H), 4.25 (br s, 2H), 5.67 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 7.19-7.36 (m, 4H), 8.42 (s, 1H), 10.06 (d, J = 8.1 Hz, 1H).
10-174		F <sub>3</sub> C(=O)NCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> H	1.38-1.43 (m, 2H), 1.44-1.52 (m, 2H), 1.65-1.80 (m, 4H), 1.88-2.00 (m, 3H), 2.68 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.69-2.76 (m, 1H), 2.88-2.98 (m, 1H), 2.91 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.00-3.10 (m, 1H), 3.25-3.37 (m, 2H), 4.24 (br s, 2H), 5.61 (q, J = 7.5 Hz, 1H), 7.18-7.39 (m, 4H), 8.42 (br s, 1H), 8.44 (s, 1H), 10.05 (d, J = 7.2 Hz, 1H).

表 7 4



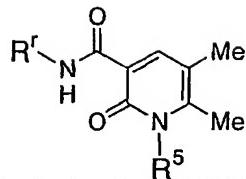
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
10-175		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.02-1.28 (m, 6H), 1.36-1.52 (m, 8H), 1.62-1.80 (m, 8H), 1.92 (br d, <i>J</i> = 12.0 Hz, 1H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.45-3.62 (m, 3H), 4.07-4.15 (m, 2H), 8.30 (s, 1H), 10.28 (br s, 1H).
10-176		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.20-1.51 (m, 14H), 1.58-1.91 (m, 8H), 2.41-2.50 (m, 1H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.36 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 8.26 (s, 1H), 10.50 (br s, 1H).
10-177		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.15 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H), 1.37-1.53 (m, 4H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.81 (m, 6H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.39-4.48 (m, 1H), 4.98 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 7.23-7.39 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.10 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-178		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.15 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.37-1.53 (m, 4H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.62-1.80 (m, 6H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.39-4.49 (m, 1H), 4.98 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 7.23-7.40 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.10 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
10-179		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.50 (m, 4H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.54 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.63-1.80 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.69-5.79 (m, 1H), 7.45-7.51 (m, 2H), 7.55-7.61 (m, 1H), 8.05-8.09 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.73 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
10-180		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.50 (m, 4H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.54 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.65-1.80 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.69-5.79 (m, 1H), 7.45-7.51 (m, 2H), 7.55-7.61 (m, 1H), 8.05-8.09 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.73 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).

表 7 5



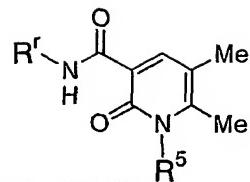
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>s</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
11-001		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.42-1.54 (m, 2H), 1.65-1.79 (m, 2H), 1.79 (s, 6H), 2.13 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.16-7.22 (m, 2H), 7.26-7.33 (m, 2H), 7.42-7.46 (m, 2H), 8.25 (s, 1H), 10.40 (br s, 1H).
11-002		Bn	1.79 (s, 6H), 2.13 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 5.50(br s, 2H), 7.09-7.47 (m, 10H), 8.35 (s, 1H), 10.35 (br s, 1H).
11-003			1.05-1.32 (m, 4H), 1.58-1.91 (m, 7H), 1.79 (s, 6H), 2.12 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 4.01 (br s, 2H), 7.16-7.21 (m, 1H), 7.26-7.32 (m, 2H), 7.43-7.46 (m, 2H), 8.24 (s, 1H), 10.39 (br s, 1H).
11-004			1.00-1.30 (m, 4H), 1.55-1.90 (m, 7H), 2.18 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 3.89-4.00 (m, 2H), 4.03 (br s, 2H), 5.26-5.32 (m, 1H), 7.26-7.43 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.72 (br d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
11-005			1.00-1.30 (m, 4H), 1.60-1.92 (m, 7H), 2.17 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.90 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.04 (br s, 2H), 5.50-5.56 (m, 1H), 7.26-7.44 (m, 5H), 8.30 (s, 1H), 10.73 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
11-006			1.00-1.30 (m, 4H), 1.56-1.88 (m, 7H), 1.90-2.00 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.71 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 3.46 (quint, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 4.03 (br s, 2H), 7.14-7.30 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 9.98 (br s, 1H).
11-007		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.39-1.51 (m, 2H), 1.62-1.73 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 3.89-4.00 (m, 2H), 4.12 (dd, <i>J</i> = 9.0 Hz, <i>J</i> = 5.1 Hz, 2H), 5.26-5.32 (m, 1H), 7.26-7.43 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.72 (br d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
11-008		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.41-1.53 (m, 2H), 1.64-1.74 (m, 2H), 2.16 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 3.91 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.50-5.57 (m, 1H), 7.28-7.45 (m, 5H), 8.30 (s, 1H), 10.73 (br d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
11-009			0.84 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 6H), 1.06-1.85 (m, 21H), 2.17 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 4.00 (br s, 2H), 4.09-4.18 (m, 1H), 8.31 (s, 1H), 9.77 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).

表 7 6



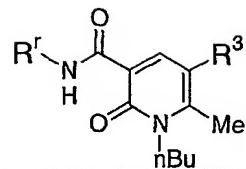
化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
11-010			0.60-0.65 (m, 2H), 0.77-0.84 (m, 2H), 1.05-1.26 (m, 5H), 1.59-1.85 (m, 6H), 2.18 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.89-2.98 (m, 1H), 4.00 (br s, 2H), 8.32 (s, 1H), 9.89 (br s, 1H).
11-011			0.86-2.19 (m, 15H), 2.19 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.72-2.91 (m, 2H), 3.94 (br s, 2H), 5.37-5.44 (m, 1H), 7.06-7.16 (m, 3H), 7.34-7.37 (m, 1H), 8.38 (s, 1H), 10.22 (br d, J = 8.7 Hz, 1H).
11-012			0.92 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.06-1.85 (m, 14H), 2.18 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.20-3.29 (m, 1H), 3.34-3.42 (m, 1H), 4.03 (br s, 2H), 8.32 (s, 1H), 9.95 (br s, 1H).
11-013			0.98 (s, 9H), 1.07-1.23 (m, 5H), 1.62-1.83 (m, 6H), 2.18 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.26 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 4.03 (br s, 2H), 8.33 (s, 1H), 10.06 (br s, 1H).
11-014			1.05-1.23 (m, 5H), 1.62-1.87 (m, 6H), 2.18 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 4.00 (br s, 2H), 4.62 (d, J = 5.4 Hz, 2H), 6.25-6.31 (m, 2H), 7.35 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 10.23 (br s, 1H).
11-015			0.88 (d, J = 6.9 Hz, 3H), 0.93 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.16-1.30 (m, 1H), 1.35-1.48 (m, 1H), 1.89-2.00 (m, 1H), 2.19 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 4.03 (br s, 1H), 4.64 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 7.20-7.38 (m, 5H), 8.37 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
11-016			0.90 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.17-1.32 (m, 1H), 1.35-1.49 (m, 1H), 1.88-2.00 (m, 1H), 2.18 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.93 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.62-3.69 (m, 2H), 4.06 (br s, 2H), 7.17-7.31 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).
11-017			0.98 (s, 9H), 2.18 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 4.34 (br s, 2H), 7.20-7.37 (m, 5H), 8.34 (s, 1H), 10.31 (br s, 1H).
11-018			0.99 (s, 9H), 2.17 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.91 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 7.16-7.31 (m, 5H), 8.30 (s, 1H), 10.01 (br s, 1H).
11-019			2.19 (s, 3H), 2.53 (s, 3H), 4.63 (d, J = 5.7 Hz, 2H), 5.34 (s, 2H), 6.33 (m, 2H), 7.21-7.37 (m, 6H), 8.38 (s, 1H), 10.18 (br s, 1H).

表 7 7



化合物 No.	R'	R <sup>5</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
11-020			2.19 (s, 3H), 2.53 (s, 3H), 2.92 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.62-3.69 (m, 2H), 5.34 (s, 2H), 6.35 (m, 2H), 7.17-7.32 (m, 5H), 7.35 (t, J = 1.5 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 9.92 (br s, 1H).
11-021			0.45-0.66 (m, 4H), 1.08-1.18 (m, 1H), 2.19 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 4.11 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 4.64 (d, J = 5.7 Hz, 2H), 7.20-7.38 (m, 5H), 8.36 (s, 1H), 10.31 (br s, 1H).
11-022			0.47-0.61 (m, 4H), 1.09-1.17 (m, 1H), 2.19 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 2.93 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 3.63-6.70 (m, 2H), 4.12 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 7.17-7.32 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).
11-023	H	nBu	1.00 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.53 (m, 2H), 1.63-1.73 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 4.13 (t, J = 8.1 Hz, 2H), 5.73 (br s, 1H), 8.31 (s, 1H), 9.62 (br s, 1H).
11-024			1.05-1.26 (m, 6H), 1.66-1.77 (m, 4H), 1.83-1.92 (m, 1H), 2.19 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 4.08 (br s, 2H), 4.97 (d, J = 4.5 Hz, 2H), 7.50 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.61 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 8.02-8.06 (m, 2H), 8.32 (s, 1H), 10.78 (br s, 1H).
11-025		Bn	2.19 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 4.98 (d, J = 4.5 Hz, 2H), 5.52 (br s, 2H), 7.14 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.29-7.36 (m, 3H), 7.50 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.61 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 8.41 (s, 1H), 10.74 (br s, 1H).

表 7 8



化合物 No.	R <sup>r</sup>	R <sup>3</sup>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
12-001			1.04 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.42-1.54 (m, 2H), 1.67-1.78 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 3.65-3.72 (m, 2H), 4.12-4.18 (m, 8H), 8.29 (s, 1H), 9.91 (t, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H).
12-002			1.04 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.43-1.55 (m, 2H), 1.70-1.80 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.97 (m, 2H), 3.67-3.74 (m, 2H), 4.18 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 3H), 6.55 (m, 1H), 6.90-6.94 (m, 1H), 7.19-7.46 (m, 8H), 8.50 (s, 1H), 8.79 (brs, 1H), 10.14 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H).
12-003		Et	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.16 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.51 (m, 2H), 1.60-1.72 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.53 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.20-7.38 (m, 5H), 8.38 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
12-004		Et	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.16 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.61-1.73 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.52 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.11 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.17-7.32 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.04 (br s, 1H).

表 7 9

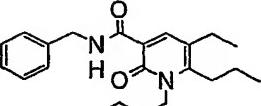
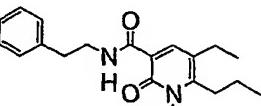
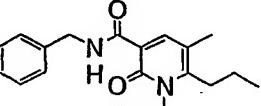
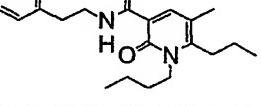
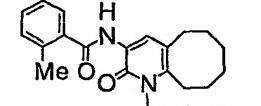
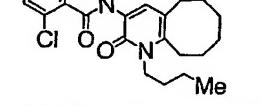
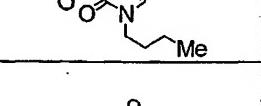
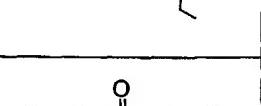
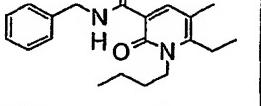
化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
13-001		0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.08 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.19 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.53-1.72 (m, 4H), 2.50 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.62-2.68 (m, 2H), 4.06 (m, 2H), 4.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.23-7.37 (m, 5H), 8.40 (s, 1H), 10.32 (br s, 1H).
13-002		1.01 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.09 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.19 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.54-1.73 (m, 4H), 2.50 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.62-2.68 (m, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.04-4.10 (m, 2H), 7.18-7.32 (m, 5H), 8.37 (s, 1H), 10.06 (br s, 1H).
13-003		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.08 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.53-1.72 (m, 4H), 2.19 (s, 3H), 2.62-2.68 (m, 2H), 4.04-4.10 (m, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 7.21-7.38 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
13-004		1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.08 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.53-1.72 (m, 4H), 2.18 (s, 3H), 2.62-2.68 (m, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.04-4.10 (m, 2H), 7.18-7.32 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).
13-005		0.98 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.53 (m, 6H), 1.62-1.72 (m, 6H), 2.54 (s, 3H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 2.83 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 7.21-7.38 (m, 2H), 7.55 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.79 (br s, 1H).
13-006		0.97 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.53 (m, 6H), 1.62-1.75 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 2.83 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 7.32-7.47 (m, 3H), 7.72-7.75 (m, 1H), 8.39 (s, 1H), 9.18 (br s, 1H).
13-007		0.97 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.46 (m, 2H), 1.72-1.82 (m, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 5.21 (s, 2H), 7.06 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz, 1H), 7.23-7.40 (m, 8H), 7.95 (s, 1H), 8.15 (br s, 1H).
13-008		0.96 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.36-1.56 (m, 6H), 1.58-1.71 (m, 4H), 1.71-1.81 (m, 2H), 2.57 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.85 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.08-3.20 (m, 2H), 3.18 (t, <i>J</i> = 5.0 Hz, 2H), 3.92 (t, <i>J</i> = 5.0 Hz, 2H), 4.06 (tlike, 2H), 6.87-7.00 (m, 5H).
13-009		0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.22 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.51 (m, 2H), 1.61-1.72 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.73 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.08 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.20-7.39 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).

表 8 0

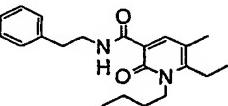
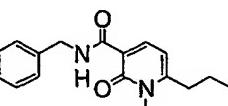
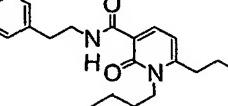
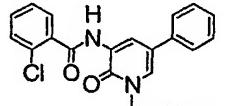
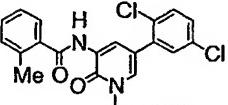
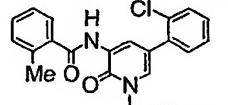
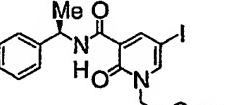
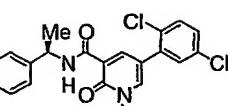
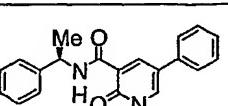
化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
13-010		1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.23 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.61-1.73 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.73 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.08 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.17-7.32 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).
13-011		0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.06 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.61-1.77 (m, 4H), 2.66 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 6.28 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H), 8.44 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 10.21 (br s, 1H).
13-012		1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.06 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.39-1.55 (m, 2H), 1.61-1.77 (m, 4H), 2.66 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.62-3.70 (m, 2H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.27 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.18-7.32 (m, 5H), 8.41 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 9.95 (br s, 1H).
13-013		0.98 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.76-1.86 (m, 2H), 4.08 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 7.26 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 7.32-7.54 (m, 8H), 7.76-7.79 (m, 1H), 8.92 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 9.29 (s, 1H).
13-014		0.99 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.60 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz), 1.77-1.87 (m, 2H), 4.09 (dt, <i>J</i> = 7.1, 3.7 Hz, 2H), 5.32 (dt, <i>J</i> = 7.3, 7.0 Hz, 1H), 7.21-7.48 (m, 5H), 7.69 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.83 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 10.29 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz).
13-015		0.98 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.76-1.86 (m, 2H), 2.54 (s, 3H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 7.18-7.59 (m, 4H), 8.70 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.84 (br s, 1H).
13-016		0.98 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.46 (m, 2H), 1.57 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 1.70-1.80 (m, 2H), 3.97 (dt, <i>J</i> = 4.3, 7.0 Hz, 2H), 5.29 (q, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 7.21-7.40 (m, 5H), 7.69 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.62 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 10.08 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H).
13-017		0.99 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.59 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 1.77-1.87 (m, 2H), 4.00-4.15 (m, 2H), 5.31 (dt, <i>J</i> = 7.6, 7.3 Hz, 1H), 7.21-7.43 (m, 3H), 7.65 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.61 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 10.19 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H).
13-018		0.99 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.60 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz), 1.77-1.87 (m, 2H), 4.09 (dt, <i>J</i> = 7.1, 3.7 Hz, 2H), 5.32 (dt, <i>J</i> = 7.3, 7.0 Hz, 1H), 7.21-7.48 (m, 5H), 7.69 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.83 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 10.29 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz).

表 8 1

化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
13-019		0.90 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.23-1.71 (m, 12H), 2.41 (br t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.68 (br t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.27 (s, 3H), 3.70-4.00 (m, 2H), 4.01 (s, 3H), 7.11-7.61 (m, 6H).
13-020		0.99 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.08 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.39-1.73 (m, 6H), 2.18 (s, 3H), 2.63-2.69 (m, 2H), 3.89-3.99 (m, 2H), 4.08 (s, 2H), 5.26-5.32 (m, 1H), 7.27-7.43 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.72 (d, $J = 5.7$ Hz, 1H).
13-021		0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.23 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.39-1.52 (m, 2H), 1.63-1.74 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.74 (q, $J = 7.5$ Hz, 2H), 3.89-4.00 (m, 2H), 4.09 (s, 2H), 5.26-5.32 (m, 1H), 7.26-7.43 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.72 (d, $J = 7.2$ Hz, 1H).
13-022		1.00 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.19-1.26 (m, 2H), 1.45 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.52-1.62 (m, 1H), 1.72 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.81-1.87 (m, 1H), 1.92-2.07 (m, 2H), 3.40 (br s, 1H), 3.47 (br s, 1H), 3.89-3.99 (m, 1H), 4.17-4.26 (m, 1H), 4.57-4.71 (m, 2H), 7.20-7.38 (m, 5H), 8.44 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
13-023		1.01 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.18-1.30 (m, 4H), 1.43-1.60 (m, 2H), 1.64-1.81 (m, 2H), 1.78 (s, 6H), 1.89-2.05 (m, 2H), 3.33 (br s, 1H), 3.47 (br s, 1H), 3.92-4.01 (m, 1H), 4.21-4.31 (m, 1H), 7.24-7.32 (m, 3H), 7.43-7.46 (m, 2H), 8.33 (s, 1H), 10.42 (br s, 1H).
13-024		1.00 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.17-1.26 (m, 2H), 1.39-1.60 (m, 4H), 1.55 (d, $J = 3.0$ Hz, 3H), 1.68-1.85 (m, 2H), 1.90-2.07 (m, 2H), 3.37 (br s, 1H), 3.47 (br s, 1H), 3.88-4.01 (m, 1H), 4.17-4.30 (m, 1H), 5.30 (quint, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.18-7.41 (m, 5H), 8.40 (s, 1H), 10.34 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H).
13-025		1.00 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.19-1.26 (m, 1H), 1.41-2.10 (m, 9H), 3.39 (br s, 1H), 3.49 (br s, 1H), 3.89-3.99 (m, 3H), 4.20-4.30 (m, 1H), 5.29 (q, $J = 6.0$ Hz, 1H), 7.26-7.43 (m, 5H), 8.40 (s, 1H), 10.71 (d, $J = 7.2$ Hz, 1H).
13-026		1.01 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.20-1.31 (m, 2H), 1.41-1.55 (m, 2H), 1.70-1.88 (m, 4H), 1.90-2.08 (m, 2H), 3.38 (br s, 1H), 3.48 (br s, 1H), 3.90 (d, $J = 4.8$ Hz, 2H), 3.95-4.02 (m, 1H), 4.20-4.31 (m, 1H), 5.50-5.58 (m, 1H), 7.26-7.44 (m, 5H), 8.39 (s, 1H), 10.74 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H).
13-027		1.00 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.08 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.40-1.72 (m, 6H), 2.17 (s, 3H), 2.63-2.68 (m, 2H), 3.90 (d, $J = 5.7$ Hz, 2H), 4.11 (br s, 2H), 5.54 (s, 1H), 7.26-7.44 (m, 5H), 8.30 (s, 1H), 10.74 (br d, $J = 7.8$ Hz, 1H).

表 8 2

化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
13-028		1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.23 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.41-1.53 (m, 2H), 1.65-1.78 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.74 (quint, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.90 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 4.11 (br s, 2H), 5.50-5.57 (m, 1H), 7.26-7.44 (m, 5H), 8.30 (s, 1H), 10.74 (br d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
13-029		0.70 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.11 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.54 (quint, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.61 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.70-3.86 (m, 2H), 5.34 (quint, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.17-7.58 (m, 10H), 8.43 (s, 1H), 10.41 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
13-030		0.72 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.12 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.57 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.78 (s, 3H), 1.82 (s, 6H), 3.81 (t, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 7.16-7.57 (m, 10H), 8.37 (s, 1H), 10.49 (br s, 1H).
13-031		0.70 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.10 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.54 (quint, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.83 (s, 3H), 3.76-3.86 (m, 2H), 3.91-4.03 (m, 2H), 5.29-5.36 (m, 1H), 7.16-7.57 (m, 10H), 8.48 (s, 1H), 10.82 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H).
13-032		0.70 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.01 (s, 9H), 1.11 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.54 (quint, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.83 (s, 3H), 3.29 (t, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 3.80 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 7.20-7.67 (m, 2H), 7.50-7.60 (m, 3H), 8.46 (s, 1H), 10.15 (br s, 1H).
13-033		0.71 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.11 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.56 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.82 (s, 3H), 3.81 (dd, <i>J</i> = 6.0 Hz, 3.6 Hz, 2H), 3.93 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 5.53-5.61 (m, 1H), 7.19-7.57 (m, 10H), 8.44 (s, 1H), 10.83 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).
13-034		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.58 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.64-1.77 (m, 4H), 1.83-1.92 (m, 2H), 2.60 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.00-4.10 (m, 2H), 5.30 (quint, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.19-7.42 (m, 5H), 8.23 (s, 1H), 10.34 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
13-035		0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 1.69-1.80 (m, 2H), 1.83-1.93 (m, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.75 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.89-3.98 (m, 2H), 4.00-4.08 (m, 2H), 5.25-5.32 (m, 1H), 7.27-7.43 (m, 5H), 8.27 (s, 1H), 10.75 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H).
13-036		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.62-1.78 (m, 4H), 1.83-1.93 (m, 2H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.75 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.91 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 5.50-5.58 (m, 1H), 7.27-7.45 (m, 5H), 8.23 (s, 1H), 10.75 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).

表 8 3

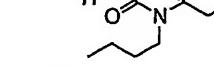
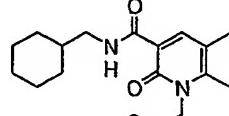
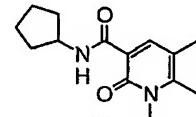
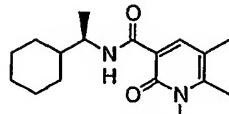
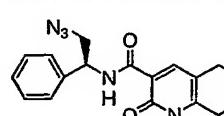
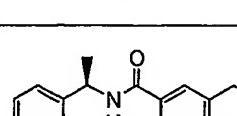
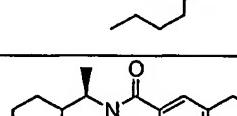
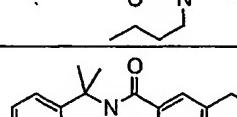
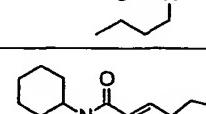
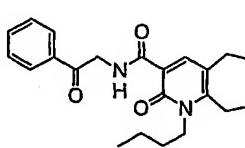
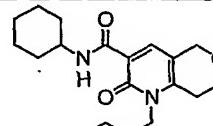
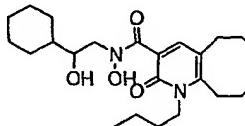
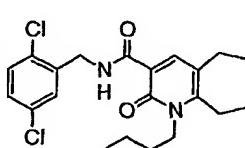
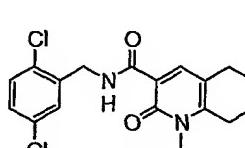
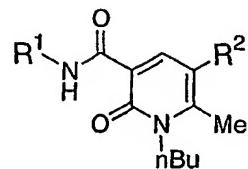
化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
13-037		0.99 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.18-1.51 (m, 8H), 1.61-1.77 (m, 6H), 1.83-1.92 (m, 2H), 1.96-2.02 (m, 2H), 2.61 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.73 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.90-4.01 (m, 1H), 4.03 (t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 8.24 (s, 1H), 9.86 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H).
13-038		0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.13-1.30 (m, 2H), 1.45 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.59-1.92 (m, 15H), 2.61 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.74 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.28 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.04 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 8.25 (s, 1H), 9.96 (br s, 1H).
13-039		0.98 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.44 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.52-1.78 (m, 10H), 1.82-1.91 (m, 2H), 1.99-2.11 (m, 2H), 2.61 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.73 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.02 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.36 (sextet, $J = 6.6$ Hz, 1H), 8.24 (s, 1H), 9.91 (d, $J = 6.9$ Hz, 1H).
13-040		0.99 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.05-1.29 (m, 6H), 1.18 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 1.45 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.59-1.92 (m, 11H), 2.61 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.73 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.93-4.18 (m, 1H+2H), 8.24 (s, 1H), 9.85 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H).
13-041		0.99 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.45 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.60-1.78 (m, 4H), 1.83-1.91 (m, 2H), 2.61 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.75 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.70 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.06 (t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 5.38-5.46 (m, 1H), 7.26-7.45 (m, 5H), 8.23 (s, 1H), 10.73 (t, $J = 8.7$ Hz, 1H).
13-042		0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.45 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.58 (d, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.68 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.82 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.00 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.05 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.58 (s, 2H), 5.29 (quint, $J = 7.2$ Hz, 1H), 7.23-7.42 (m, 5H), 8.17 (s, 1H), 10.25 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H).
13-043		0.99 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.03-1.30 (m, 4H), 1.18 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 1.45 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.60-1.84 (m, 9H), 2.82 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.92-4.18 (m, 5H), 4.59 (s, 2H), 8.18 (s, 1H), 9.77 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H).
13-044		1.01 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.47 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.71 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.79 (s, 6H), 2.82 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.00 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.05 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.54 (s, 2H), 7.26-7.34 (m, 3H), 7.42-7.46 (m, 2H), 8.11 (s, 1H), 10.84 (br s, 1H).
13-045		0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.19-1.52 (m, 8H), 1.62-1.79 (m, 8H), 1.80-1.88 (m, 2H), 1.91-2.02 (m, 2H), 2.71 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.93 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.93-4.02 (m, 1H), 4.16 (br t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 8.29 (s, 1H), 9.86 (d, $J = 6.9$ Hz, 1H).

表 8 4

化合物 No.	構造	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> )
13-046		1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.63-1.74 (m, 6H), 1.83-1.90 (m, 2H), 2.72 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.96 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.23 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.96 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 7.50 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.61 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.04 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.29 (s, 1H), 10.79 (br s, 1H).
13-047		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.22-1.49 (m, 6H), 1.60-1.78 (m, 6H), 1.94-2.01 (m, 2H), 2.82 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.91-4.05 (m, 5H), 4.60 (s, 2H), 8.18 (s, 1H), 9.79 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H).
13-048		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.10-1.29 (m, 6H), 1.40-1.56 (m, 8H), 1.65-1.82 (m, 8H), 1.93 (br t, <i>J</i> = 12.0 Hz, 1H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.78-3.87 (m, 2H), 4.00-4.12 (m, 1H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 7.29 (br s, 1H), 8.00 (s, 1H).
13-049		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.61-1.73 (m, 6H), 1.87 (sextet, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.96 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.19 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.68 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.15 (dd, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2.4 Hz, 1H), 7.23-7.29 (m, 1H), 7.39 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.31 (s, 1H), 10.43 (br s, 1H).
13-050		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.63-1.79 (m, 4H), 1.89 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.76 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 4.68 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.15 (dd, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2.4 Hz, 1H), 7.25-7.29 (m, 1H), 7.38 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 10.44 (br s, 1H).

以下の化合物も本発明に包含される。

表 8 5

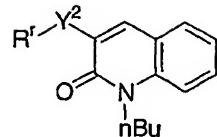


化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
3-031		Et
3-032		Et
3-041		
3-042		
3-043		CF <sub>3</sub>

表 8 6

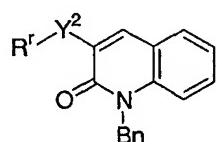
No	構造
3-017	
3-018	
3-019	
3-020	
5-021	
5-022	

表 8 7



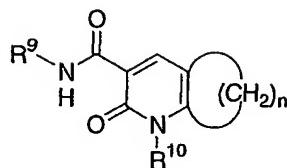
化合物 No.	Y <sup>2</sup>	R <sup>r</sup>
8-001	-C(=O)-NH-	
8-002	-C(=O)-NH-	
8-003	-C(=O)-NH-	
8-004	-C(=O)-NH-	
8-005	-C(=O)-NH-	
8-006	-C(=O)-NH-	
8-007	-C(=O)-NH-	
8-008	-NH-C(=O)-	
8-009	-NH-C(=O)-	
8-010	-NH-C(=O)-	
8-011	-NH-C(=O)-	
8-012	-NH-C(=O)-	
8-013	-NH-C(=O)-	
8-014	-NH-C(=O)-	

表 8 8



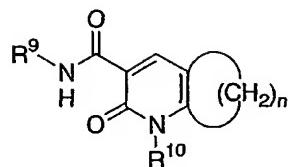
化合物 No.	Y <sup>2</sup>	R <sup>r</sup>
8-015	-C(=O)-NH-	
8-016	-C(=O)-NH-	
8-017	-C(=O)-NH-	
8-018	-C(=O)-NH-	
8-019	-C(=O)-NH-	
8-020	-C(=O)-NH-	
8-021	-C(=O)-NH-	
8-022	-NH-C(=O)-	
8-023	-NH-C(=O)-	
8-024	-NH-C(=O)-	
8-025	-NH-C(=O)-	
8-026	-NH-C(=O)-	
8-027	-NH-C(=O)-	
8-028	-NH-C(=O)-	

表 8 9



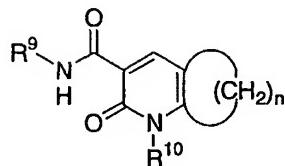
化合物番号	R9	R10	n
9-001	(4-Cl)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-002	(3-Cl)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-003	(2-Cl)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-004	(4-F)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-005	(3-F)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-006	(2-F)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-007	(4-Me)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-008	(3-Me)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-009	(2-Me)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-010	(4-MeO)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-011	(3-MeO)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-012	(2-MeO)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-013	(4-Me2N)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-014	(3-Me2N)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-015	(2-Me2N)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-016	(4-MeOCO)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-017	(3-MeOCO)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-018	(2-MeOCO)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-019	(4-CN)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-020	(3-CN)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-021	(2CN)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-022	(4NO2)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-023	(3NO2)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-024	(2NO2)C6H4CH2-	n-Bu	3
9-025	(4-Cl)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-026	(3-Cl)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-027	(2-Cl)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-028	(4-F)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-029	(3-F)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-030	(2-F)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-031	(4-Me)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-032	(3-Me)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-033	(2-Me)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-034	(4-MeO)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-035	(3-MeO)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-036	(2-MeO)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-037	(4-Me2N)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-038	(3-Me2N)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-039	(2-Me2N)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-040	(4-MeOCO)C6H4CH2-	n-Bu	4

表 9 0



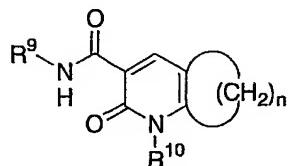
化合物番号	R9	R10	n
9-041	(3-MeOCO)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-042	(2-MeOCO)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-043	(4-CN)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-044	(3-CN)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-045	(2CN)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-046	(4NO2)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-047	(3NO2)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-048	(2NO2)C6H4CH2-	n-Bu	4
9-049	(4-Cl)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-050	(3-Cl)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-051	(2-Cl)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-052	(4-F)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-053	(3-F)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-054	(2-F)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-055	(4-Me)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-056	(3-Me)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-057	(2-Me)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-058	(4-MeO)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-059	(3-MeO)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-060	(2-MeO)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-061	(4-Me2N)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-062	(3-Me2N)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-063	(2-Me2N)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-064	(4-MeOCO)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-065	(3-MeOCO)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-066	(2-MeOCO)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-067	(4-CN)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-068	(3-CN)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-069	(2CN)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-070	(4NO2)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-071	(3NO2)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-072	(2NO2)C6H4CH2-	n-Bu	5
9-073	(4-Cl)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-074	(3-Cl)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-075	(2-Cl)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-076	(4-F)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-077	(3-F)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-078	(2-F)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-079	(4-Me)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-080	(3-Me)C6H4CH2-	n-Bu	6

表 9 1



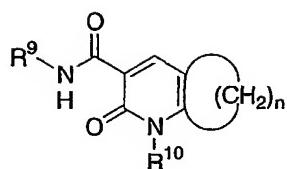
化合物番号	R9	R10	n
9-081	(2-Me)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-082	(4-MeO)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-083	(3-MeO)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-084	(2-MeO)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-085	(4-Me2N)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-086	(3-Me2N)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-087	(2-Me2N)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-088	(4-MeOCO)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-089	(3-MeOCO)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-090	(2-MeOCO)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-091	(4-CN)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-092	(3-CN)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-093	(2CN)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-094	(4NO2)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-095	(3NO2)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-096	(2NO2)C6H4CH2-	n-Bu	6
9-097	(4-Cl)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-098	(3-Cl)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-099	(2-Cl)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-100	(4-F)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-101	(3-F)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-102	(2-F)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-103	(4-Me)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-104	(3-Me)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-105	(2-Me)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-106	(4-MeO)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-107	(3-MeO)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-108	(2-MeO)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-109	(4-Me2N)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-110	(3-Me2N)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-111	(2-Me2N)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-112	(4-MeOCO)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-113	(3-MeOCO)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-114	(2-MeOCO)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-115	(4-CN)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-116	(3-CN)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-117	(2CN)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-118	(4NO2)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-119	(3NO2)C6H4CH2-	Bnzyl	3
9-120	(2NO2)C6H4CH2-	Bnzyl	3

表 9 2



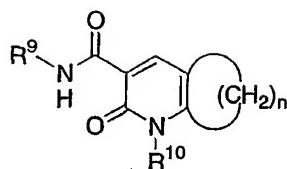
化合物番号	R9	R10	n
9-121	(4-Cl)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-122	(3-Cl)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-123	(2-Cl)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-124	(4-F)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-125	(3-F)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-126	(2-F)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-127	(4-Me)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-128	(3-Me)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-129	(2-Me)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-130	(4-MeO)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-131	(3-MeO)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-132	(2-MeO)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-133	(4-Me2N)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-134	(3-Me2N)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-135	(2-Me2N)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-136	(4-MeOCO)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-137	(3-MeOCO)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-138	(2-MeOCO)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-139	(4-CN)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-140	(3-CN)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-141	(2CN)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-142	(4NO2)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-143	(3NO2)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-144	(2NO2)C6H4CH2-	Benzyl	4
9-145	(4-Cl)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-146	(3-Cl)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-147	(2-Cl)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-148	(4-F)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-149	(3-F)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-150	(2-F)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-151	(4-Me)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-152	(3-Me)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-153	(2-Me)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-154	(4-MeO)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-155	(3-MeO)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-156	(2-MeO)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-157	(4-Me2N)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-158	(3-Me2N)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-159	(2-Me2N)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-160	(4-MeOCO)C6H4CH2-	Benzyl	5

表 9 3



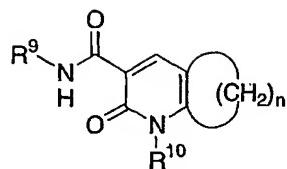
化合物番号	R9	R10	n
9-161	(3-MeOCO)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-162	(2-MeOCO)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-163	(4-CN)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-164	(3-CN)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-165	(2CN)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-166	(4NO2)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-167	(3NO2)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-168	(2NO2)C6H4CH2-	Benzyl	5
9-169	(4-Cl)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-170	(3-Cl)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-171	(2-Cl)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-172	(4-F)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-173	(3-F)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-174	(2-F)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-175	(4-Me)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-176	(3-Me)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-177	(2-Me)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-178	(4-MeO)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-179	(3-MeO)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-180	(2-MeO)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-181	(4-Me2N)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-182	(3-Me2N)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-183	(2-Me2N)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-184	(4-MeOCO)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-185	(3-MeOCO)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-186	(2-MeOCO)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-187	(4-CN)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-188	(3-CN)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-189	(2CN)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-190	(4NO2)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-191	(3NO2)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-192	(2NO2)C6H4CH2-	Benzyl	6
9-193	(4-Cl)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-194	(3-Cl)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-195	(2-Cl)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-196	(4-F)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-197	(3-F)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-198	(2-F)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-199	(4-Me)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-200	(3-Me)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3

表 9 4



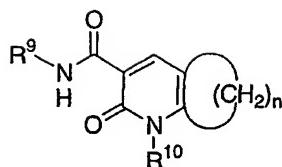
化合物番号	R9	R10	n
9-201	(2-Me)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-202	(4-MeO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-203	(3-MeO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-204	(2-MeO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-205	(4-Me2N)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-206	(3-Me2N)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-207	(2-Me2N)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-208	(4-MeOCO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-209	(3-MeOCO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-210	(2-MeOCO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-211	(4-CN)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-212	(3-CN)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-213	(2CN)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-214	(4NO2)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-215	(3NO2)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-216	(2NO2)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-217	(4-Cl)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-218	(3-Cl)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-219	(2-Cl)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-220	(4-F)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-221	(3-F)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-222	(2-F)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-223	(4-Me)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-224	(3-Me)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-225	(2-Me)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-226	(4-MeO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-227	(3-MeO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-228	(2-MeO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-229	(4-Me2N)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-230	(3-Me2N)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-231	(2-Me2N)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-232	(4-MeOCO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-233	(3-MeOCO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-234	(2-MeOCO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-235	(4-CN)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-236	(3-CN)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-237	(2CN)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-238	(4NO2)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-239	(3NO2)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-240	(2NO2)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	4

表 9 5



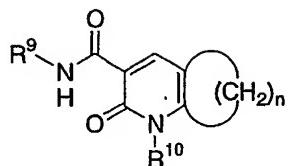
化合物番号	R9	R10	n
9-241	(4-Cl)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-242	(3-Cl)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-243	(2-Cl)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-244	(4-F)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-245	(3-F)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-246	(2-F)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-247	(4-Me)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-248	(3-Me)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-249	(2-Me)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-250	(4-MeO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-251	(3-MeO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-252	(2-MeO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-253	(4-Me2N)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-254	(3-Me2N)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-255	(2-Me2N)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-256	(4-MeOCO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-257	(3-MeOCO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-258	(2-MeOCO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-259	(4-CN)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-260	(3-CN)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-261	(2CN)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-262	(4NO2)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-263	(3NO2)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-264	(2NO2)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-265	(4-Cl)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-266	(3-Cl)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-267	(2-Cl)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-268	(4-F)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-269	(3-F)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-270	(2-F)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-271	(4-Me)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-272	(3-Me)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-273	(2-Me)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-274	(4-MeO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-275	(3-MeO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-276	(2-MeO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-277	(4-Me2N)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-278	(3-Me2N)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-279	(2-Me2N)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-280	(4-MeOCO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6

表 9 6



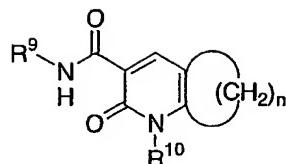
化合物番号	R9	R10	n
9-281	(3-MeOCO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-282	(2-MeOCO)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-283	(4-CN)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-284	(3-CN)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-285	(2CN)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-286	(4NO2)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-287	(3NO2)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-288	(2NO2)C6H4CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-289	(4-Cl)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-290	(3-Cl)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-291	(2-Cl)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-292	(4-F)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-293	(3-F)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-294	(2-F)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-295	(4-Me)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-296	(3-Me)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-297	(2-Me)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-298	(4-MeO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-299	(3-MeO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-300	(2-MeO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-301	(4-Me2N)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-302	(3-Me2N)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-303	(2-Me2N)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-304	(4-MeOCO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-305	(3-MeOCO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-306	(2-MeOCO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-307	(4-CN)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-308	(3-CN)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-309	(2CN)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-310	(4NO2)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-311	(3NO2)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-312	(2NO2)C6H4CH2CH2-	n-Bu	3
9-313	(4-Cl)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-314	(3-Cl)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-315	(2-Cl)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-316	(4-F)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-317	(3-F)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-318	(2-F)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-319	(4-Me)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-320	(3-Me)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4

表 9 7



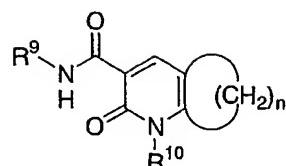
化合物番号	R9	R10	n
9-321	(2-Me)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-322	(4-MeO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-323	(3-MeO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-324	(2-MeO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-325	(4-Me2N)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-326	(3-Me2N)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-327	(2-Me2N)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-328	(4-MeOCO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-329	(3-MeOCO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-330	(2-MeOCO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-331	(4-CN)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-332	(3-CN)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-333	(2CN)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-334	(4NO2)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-335	(3NO2)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-336	(2NO2)C6H4CH2CH2-	n-Bu	4
9-337	(4-Cl)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-338	(3-Cl)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-339	(2-Cl)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-340	(4-F)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-341	(3-F)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-342	(2-F)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-343	(4-Me)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-344	(3-Me)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-345	(2-Me)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-346	(4-MeO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-347	(3-MeO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-348	(2-MeO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-349	(4-Me2N)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-350	(3-Me2N)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-351	(2-Me2N)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-352	(4-MeOCO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-353	(3-MeOCO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-354	(2-MeOCO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-355	(4-CN)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-356	(3-CN)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-357	(2CN)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-358	(4NO2)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-359	(3NO2)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5
9-360	(2NO2)C6H4CH2CH2-	n-Bu	5

表 9 8



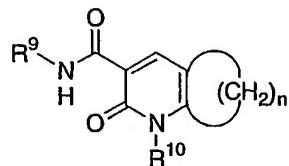
化合物番号	R9	R10	n
9-361	(4-Cl)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-362	(3-Cl)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-363	(2-Cl)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-364	(4-F)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-365	(3-F)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-366	(2-F)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-367	(4-Me)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-368	(3-Me)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-369	(2-Me)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-370	(4-MeO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-371	(3-MeO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-372	(2-MeO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-373	(4-Me2N)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-374	(3-Me2N)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-375	(2-Me2N)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-376	(4-MeOCO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-377	(3-MeOCO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-378	(2-MeOCO)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-379	(4-CN)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-380	(3-CN)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-381	(2CN)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-382	(4NO2)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-383	(3NO2)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-384	(2NO2)C6H4CH2CH2-	n-Bu	6
9-385	(4-Cl)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-386	(3-Cl)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-387	(2-Cl)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-388	(4-F)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-389	(3-F)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-390	(2-F)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-391	(4-Me)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-392	(3-Me)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-393	(2-Me)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-394	(4-MeO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-395	(3-MeO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-396	(2-MeO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-397	(4-Me2N)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-398	(3-Me2N)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-399	(2-Me2N)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-400	(4-MeOCO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3

表 9 9



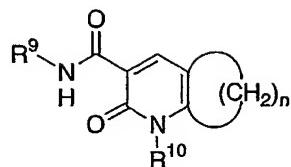
化合物番号	R9	R10	n
9-401	(3-MeOCO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-402	(2-MeOCO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-403	(4-CN)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-404	(3-CN)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-405	(2CN)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-406	(4NO2)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-407	(3NO2)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-408	(2NO2)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	3
9-409	(4-Cl)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-410	(3-Cl)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-411	(2-Cl)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-412	(4-F)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-413	(3-F)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-414	(2-F)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-415	(4-Me)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-416	(3-Me)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-417	(2-Me)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-418	(4-MeO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-419	(3-MeO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-420	(2-MeO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-421	(4-Me2N)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-422	(3-Me2N)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-423	(2-Me2N)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-424	(4-MeOCO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-425	(3-MeOCO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-426	(2-MeOCO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-427	(4-CN)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-428	(3-CN)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-429	(2CN)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-430	(4NO2)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-431	(3NO2)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-432	(2NO2)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	4
9-433	(4-Cl)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-434	(3-Cl)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-435	(2-Cl)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-436	(4-F)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-437	(3-F)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-438	(2-F)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-439	(4-Me)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-440	(3-Me)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5

表 100



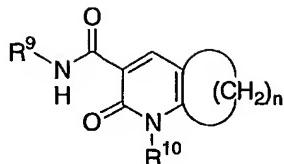
化合物番号	R9	R10	n
9-441	(2-Me)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-442	(4-MeO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-443	(3-MeO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-444	(2-MeO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-445	(4-Me2N)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-446	(3-Me2N)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-447	(2-Me2N)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-448	(4-MeOCO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-449	(3-MeOCO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-450	(2-MeOCO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-451	(4-CN)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-452	(3-CN)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-453	(2CN)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-454	(4NO2)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-455	(3NO2)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-456	(2NO2)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	5
9-457	(4-Cl)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-458	(3-Cl)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-459	(2-Cl)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-460	(4-F)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-461	(3-F)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-462	(2-F)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-463	(4-Me)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-464	(3-Me)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-465	(2-Me)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-466	(4-MeO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-467	(3-MeO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-468	(2-MeO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-469	(4-Me2N)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-470	(3-Me2N)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-471	(2-Me2N)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-472	(4-MeOCO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-473	(3-MeOCO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-474	(2-MeOCO)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-475	(4-CN)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-476	(3-CN)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-477	(2CN)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-478	(4NO2)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-479	(3NO2)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6
9-480	(2NO2)C6H4CH2CH2-	Bnzy1	6

表 101



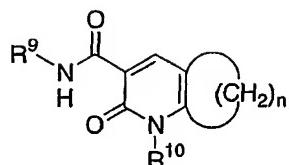
化合物番号	R9	R10	n
9-481	(4-Cl)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-482	(3-Cl)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-483	(2-Cl)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-484	(4-F)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-485	(3-F)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-486	(2-F)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-487	(4-Me)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-488	(3-Me)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-489	(2-Me)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-490	(4-MeO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-491	(3-MeO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-492	(2-MeO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-493	(4-Me2N)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-494	(3-Me2N)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-495	(2-Me2N)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-496	(4-MeOCO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-497	(3-MeOCO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-498	(2-MeOCO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-499	(4-CN)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-500	(3-CN)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-501	(2CN)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-502	(4NO <sub>2</sub> )C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-503	(3NO <sub>2</sub> )C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-504	(2NO <sub>2</sub> )C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	3
9-505	(4-Cl)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-506	(3-Cl)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-507	(2-Cl)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-508	(4-F)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-509	(3-F)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-510	(2-F)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-511	(4-Me)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-512	(3-Me)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-513	(2-Me)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-514	(4-MeO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-515	(3-MeO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-516	(2-MeO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-517	(4-Me2N)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-518	(3-Me2N)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-519	(2-Me2N)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-520	(4-MeOCO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4

表 102



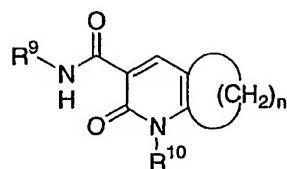
化合物番号	R9	R10	n
9-521	(3-MeOCO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-522	(2-MeOCO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-523	(4-CN)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-524	(3-CN)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-525	(2CN)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-526	(4NO2)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-527	(3NO2)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-528	(2NO2)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	4
9-529	(4-Cl)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-530	(3-Cl)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-531	(2-Cl)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-532	(4-F)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-533	(3-F)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-534	(2-F)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-535	(4-Me)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-536	(3-Me)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-537	(2-Me)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-538	(4-MeO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-539	(3-MeO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-540	(2-MeO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-541	(4-Me2N)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-542	(3-Me2N)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-543	(2-Me2N)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-544	(4-MeOCO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-545	(3-MeOCO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-546	(2-MeOCO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-547	(4-CN)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-548	(3-CN)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-549	(2CN)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-550	(4NO2)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-551	(3NO2)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-552	(2NO2)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	5
9-553	(4-Cl)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-554	(3-Cl)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-555	(2-Cl)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-556	(4-F)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-557	(3-F)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-558	(2-F)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-559	(4-Me)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-560	(3-Me)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6

表 103



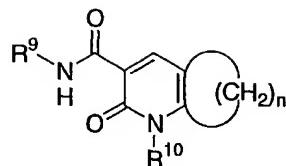
化合物番号	R9	R10	n
9-561	(2-Me)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-562	(4-MeO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-563	(3-MeO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-564	(2-MeO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-565	(4-Me2N)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-566	(3-Me2N)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-567	(2-Me2N)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-568	(4-MeOCO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-569	(3-MeOCO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-570	(2-MeOCO)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-571	(4-CN)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-572	(3-CN)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-573	(2CN)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-574	(4NO2)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-575	(3NO2)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-576	(2NO2)C6H4CH2CH2-	4-pyridyl-CH2-	6
9-577	(4-Cl)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-578	(3-Cl)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-579	(2-Cl)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-580	(4-F)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-581	(3-F)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-582	(2-F)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-583	(4-Me)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-584	(3-Me)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-585	(2-Me)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-586	(4-MeO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-587	(3-MeO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-588	(2-MeO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-589	(4-Me2N)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-590	(3-Me2N)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-591	(2-Me2N)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-592	(4-MeOCO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-593	(3-MeOCO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-594	(2-MeOCO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-595	(4-CN)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-596	(3-CN)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-597	(2CN)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-598	(4NO2)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-599	(3NO2)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3
9-600	(2NO2)C6H4CH(Me)-	n-Bu	3

表 104



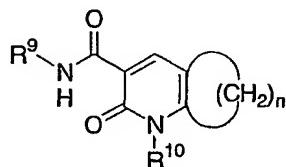
化合物番号	R9	R10	n
9-601	(4-Cl)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-602	(3-Cl)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-603	(2-Cl)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-604	(4-F)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-605	(3-F)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-606	(2-F)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-607	(4-Me)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-608	(3-Me)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-609	(2-Me)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-610	(4-MeO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-611	(3-MeO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-612	(2-MeO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-613	(4-Me2N)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-614	(3-Me2N)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-615	(2-Me2N)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-616	(4-MeOCO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-617	(3-MeOCO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-618	(2-MeOCO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-619	(4-CN)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-620	(3-CN)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-621	(2CN)C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-622	(4NO <sub>2</sub> )C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-623	(3NO <sub>2</sub> )C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-624	(2NO <sub>2</sub> )C6H4CH(Me)-	n-Bu	4
9-625	(4-Cl)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-626	(3-Cl)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-627	(2-Cl)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-628	(4-F)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-629	(3-F)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-630	(2-F)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-631	(4-Me)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-632	(3-Me)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-633	(2-Me)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-634	(4-MeO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-635	(3-MeO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-636	(2-MeO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-637	(4-Me2N)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-638	(3-Me2N)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-639	(2-Me2N)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-640	(4-MeOCO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5

表 105



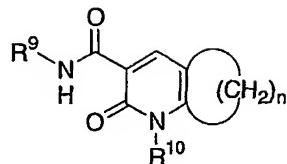
化合物番号	R9	R10	n
9-641	(3-MeOCO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-642	(2-MeOCO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-643	(4-CN)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-644	(3-CN)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-645	(2CN)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-646	(4NO2)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-647	(3NO2)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-648	(2NO2)C6H4CH(Me)-	n-Bu	5
9-649	(4-Cl)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-650	(3-Cl)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-651	(2-Cl)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-652	(4-F)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-653	(3-F)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-654	(2-F)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-655	(4-Me)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-656	(3-Me)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-657	(2-Me)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-658	(4-MeO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-659	(3-MeO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-660	(2-MeO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-661	(4-Me2N)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-662	(3-Me2N)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-663	(2-Me2N)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-664	(4-MeOCO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-665	(3-MeOCO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-666	(2-MeOCO)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-667	(4-CN)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-668	(3-CN)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-669	(2CN)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-670	(4NO2)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-671	(3NO2)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-672	(2NO2)C6H4CH(Me)-	n-Bu	6
9-673	(4-Cl)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-674	(3-Cl)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-675	(2-Cl)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-676	(4-F)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-677	(3-F)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-678	(2-F)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-679	(4-Me)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-680	(3-Me)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3

表 106



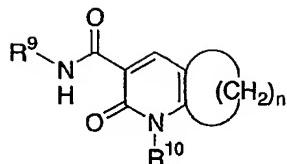
化合物番号	R9	R10	n
9-681	(2-Me)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-682	(4-MeO)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-683	(3-MeO)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-684	(2-MeO)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-685	(4-Me2N)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-686	(3-Me2N)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-687	(2-Me2N)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-688	(4-MeOCO)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-689	(3-MeOCO)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-690	(2-MeOCO)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-691	(4-CN)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-692	(3-CN)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-693	(2CN)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-694	(4NO2)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-695	(3NO2)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-696	(2NO2)C6H4CH(Me)-	Benzyl	3
9-697	(4-Cl)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-698	(3-Cl)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-699	(2-Cl)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-700	(4-F)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-701	(3-F)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-702	(2-F)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-703	(4-Me)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-704	(3-Me)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-705	(2-Me)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-706	(4-MeO)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-707	(3-MeO)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-708	(2-MeO)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-709	(4-Me2N)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-710	(3-Me2N)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-711	(2-Me2N)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-712	(4-MeOCO)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-713	(3-MeOCO)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-714	(2-MeOCO)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-715	(4-CN)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-716	(3-CN)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-717	(2CN)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-718	(4NO2)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-719	(3NO2)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4
9-720	(2NO2)C6H4CH(Me)-	Benzyl	4

表 107



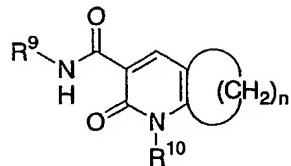
化合物番号	R9	R10	n
9-721	(4-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-722	(3-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-723	(2-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-724	(4-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-725	(3-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-726	(2-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-727	(4-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-728	(3-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-729	(2-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-730	(4-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-731	(3-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-732	(2-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-733	(4-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-734	(3-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-735	(2-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-736	(4-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-737	(3-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-738	(2-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-739	(4-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-740	(3-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-741	(2CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-742	(4NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-743	(3NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-744	(2NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	5
9-745	(4-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6
9-746	(3-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6
9-747	(2-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6
9-748	(4-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6
9-749	(3-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6
9-750	(2-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6
9-751	(4-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6
9-752	(3-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6
9-753	(2-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6
9-754	(4-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6
9-755	(3-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6
9-756	(2-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6
9-757	(4-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6
9-758	(3-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6
9-759	(2-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6
9-760	(4-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH(Me)-	Bnzy1	6

表 108



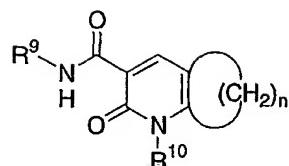
化合物番号	R9	R10	n
9-761	(3-MeOCO)C6H4CH(Me)-	Benzyl	6
9-762	(2-MeOCO)C6H4CH(Me)-	Benzyl	6
9-763	(4-CN)C6H4CH(Me)-	Benzyl	6
9-764	(3-CN)C6H4CH(Me)-	Benzyl	6
9-765	(2CN)C6H4CH(Me)-	Benzyl	6
9-766	(4NO2)C6H4CH(Me)-	Benzyl	6
9-767	(3NO2)C6H4CH(Me)-	Benzyl	6
9-768	(2NO2)C6H4CH(Me)-	Benzyl	6
9-769	(4-Cl)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-770	(3-Cl)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-771	(2-Cl)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-772	(4-F)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-773	(3-F)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-774	(2-F)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-775	(4-Me)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-776	(3-Me)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-777	(2-Me)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-778	(4-MeO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-779	(3-MeO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-780	(2-MeO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-781	(4-Me2N)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-782	(3-Me2N)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-783	(2-Me2N)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-784	(4-MeOCO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-785	(3-MeOCO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-786	(2-MeOCO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-787	(4-CN)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-788	(3-CN)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-789	(2CN)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-790	(4NO2)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-791	(3NO2)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-792	(2NO2)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-793	(4-Cl)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-794	(3-Cl)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-795	(2-Cl)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-796	(4-F)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-797	(3-F)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-798	(2-F)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-799	(4-Me)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-800	(3-Me)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4

表 109



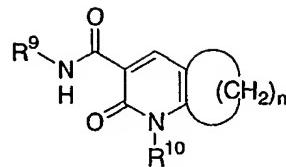
化合物番号	R9	R10	n
9-801	(2-Me)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-802	(4-MeO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-803	(3-MeO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-804	(2-MeO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-805	(4-Me2N)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-806	(3-Me2N)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-807	(2-Me2N)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-808	(4-MeOCO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-809	(3-MeOCO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-810	(2-MeOCO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-811	(4-CN)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-812	(3-CN)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-813	(2CN)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-814	(4NO2)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-815	(3NO2)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-816	(2NO2)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-817	(4-Cl)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-818	(3-Cl)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-819	(2-Cl)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-820	(4-F)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-821	(3-F)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-822	(2-F)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-823	(4-Me)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-824	(3-Me)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-825	(2-Me)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-826	(4-MeO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-827	(3-MeO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-828	(2-MeO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-829	(4-Me2N)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-830	(3-Me2N)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-831	(2-Me2N)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-832	(4-MeOCO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-833	(3-MeOCO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-834	(2-MeOCO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-835	(4-CN)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-836	(3-CN)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-837	(2CN)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-838	(4NO2)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-839	(3NO2)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-840	(2NO2)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	5

表 110



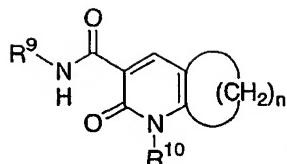
化合物番号	R9	R10	n
9-841	(4-Cl)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-842	(3-Cl)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-843	(2-Cl)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-844	(4-F)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-845	(3-F)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-846	(2-F)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-847	(4-Me)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-848	(3-Me)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-849	(2-Me)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-850	(4-MeO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-851	(3-MeO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-852	(2-MeO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-853	(4-Me2N)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-854	(3-Me2N)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-855	(2-Me2N)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-856	(4-MeOCO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-857	(3-MeOCO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-858	(2-MeOCO)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-859	(4-CN)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-860	(3-CN)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-861	(2CN)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-862	(4NO2)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-863	(3NO2)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-864	(2NO2)C6H4CH(Me)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-865	(4-Cl)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-866	(3-Cl)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-867	(2-Cl)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-868	(4-F)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-869	(3-F)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-870	(2-F)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-871	(4-Me)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-872	(3-Me)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-873	(2-Me)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-874	(4-MeO)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-875	(3-MeO)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-876	(2-MeO)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-877	(4-Me2N)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-878	(3-Me2N)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-879	(2-Me2N)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-880	(4-MeOCO)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3

表 111



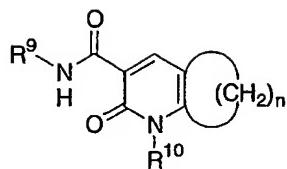
化合物番号	R9	R10	n
9-881	(3-MeOCO)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-882	(2-MeOCO)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-883	(4-CN)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-884	(3-CN)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-885	(2CN)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-886	(4NO2)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-887	(3NO2)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-888	(2NO2)C6H4C(Me2)-	n-Bu	3
9-889	(4-Cl)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-890	(3-Cl)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-891	(2-Cl)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-892	(4-F)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-893	(3-F)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-894	(2-F)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-895	(4-Me)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-896	(3-Me)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-897	(2-Me)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-898	(4-MeO)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-899	(3-MeO)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-900	(2-MeO)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-901	(4-Me2N)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-902	(3-Me2N)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-903	(2-Me2N)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-904	(4-MeOCO)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-905	(3-MeOCO)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-906	(2-MeOCO)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-907	(4-CN)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-908	(3-CN)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-909	(2CN)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-910	(4NO2)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-911	(3NO2)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-912	(2NO2)C6H4C(Me2)-	n-Bu	4
9-913	(4-Cl)C6H4C(Me2)-	n-Bu	5
9-914	(3-Cl)C6H4C(Me2)-	n-Bu	5
9-915	(2-Cl)C6H4C(Me2)-	n-Bu	5
9-916	(4-F)C6H4C(Me2)-	n-Bu	5
9-917	(3-F)C6H4C(Me2)-	n-Bu	5
9-918	(2-F)C6H4C(Me2)-	n-Bu	5
9-919	(4-Me)C6H4C(Me2)-	n-Bu	5
9-920	(3-Me)C6H4C(Me2)-	n-Bu	5

表 1 1 2



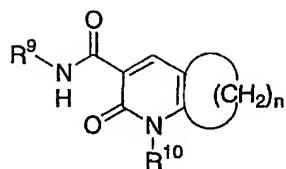
化合物番号	R9	R10	n
9-921	(2-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-922	(4-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-923	(3-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-924	(2-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-925	(4-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-926	(3-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-927	(2-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-928	(4-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-929	(3-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-930	(2-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-931	(4-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-932	(3-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-933	(2CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-934	(4NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-935	(3NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-936	(2NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	5
9-937	(4-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-938	(3-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-939	(2-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-940	(4-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-941	(3-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-942	(2-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-943	(4-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-944	(3-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-945	(2-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-946	(4-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-947	(3-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-948	(2-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-949	(4-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-950	(3-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-951	(2-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-952	(4-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-953	(3-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-954	(2-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-955	(4-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-956	(3-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-957	(2CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-958	(4NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-959	(3NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6
9-960	(2NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	6

表 1 1 3



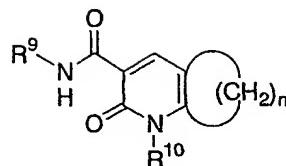
化合物番号	R9	R10	n
9-961	(4-Cl)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-962	(3-Cl)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-963	(2-Cl)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-964	(4-F)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-965	(3-F)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-966	(2-F)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-967	(4-Me)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-968	(3-Me)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-969	(2-Me)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-970	(4-MeO)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-971	(3-MeO)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-972	(2-MeO)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-973	(4-Me2N)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-974	(3-Me2N)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-975	(2-Me2N)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-976	(4-MeOCO)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-977	(3-MeOCO)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-978	(2-MeOCO)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-979	(4-CN)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-980	(3-CN)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-981	(2-CN)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-982	(4NO2)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-983	(3NO2)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-984	(2NO2)C6H4C(Me2)-	Benzyl	3
9-985	(4-Cl)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4
9-986	(3-Cl)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4
9-987	(2-Cl)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4
9-988	(4-F)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4
9-989	(3-F)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4
9-990	(2-F)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4
9-991	(4-Me)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4
9-992	(3-Me)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4
9-993	(2-Me)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4
9-994	(4-MeO)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4
9-995	(3-MeO)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4
9-996	(2-MeO)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4
9-997	(4-Me2N)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4
9-998	(3-Me2N)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4
9-999	(2-Me2N)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4
9-1000	(4-MeOCO)C6H4C(Me2)-	Benzyl	4

表 114



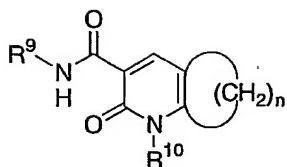
化合物番号	R9	R10	n
9-1001	(3-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	4
9-1002	(2-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	4
9-1003	(4-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	4
9-1004	(3-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	4
9-1005	(2CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	4
9-1006	(4NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	4
9-1007	(3NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	4
9-1008	(2NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	4
9-1009	(4-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1010	(3-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1011	(2-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1012	(4-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1013	(3-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1014	(2-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1015	(4-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1016	(3-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1017	(2-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1018	(4-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1019	(3-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1020	(2-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1021	(4-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1022	(3-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1023	(2-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1024	(4-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1025	(3-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1026	(2-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1027	(4-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1028	(3-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1029	(2CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1030	(4NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1031	(3NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1032	(2NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	5
9-1033	(4-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	6
9-1034	(3-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	6
9-1035	(2-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	6
9-1036	(4-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	6
9-1037	(3-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	6
9-1038	(2-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	6
9-1039	(4-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	6
9-1040	(3-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	Bnzy1	6

表 115



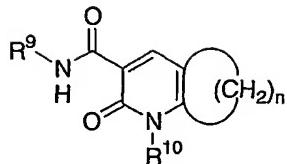
化合物番号	R9	R10	n
9-1041	(2-Me)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1042	(4-MeO)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1043	(3-MeO)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1044	(2-MeO)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1045	(4-Me2N)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1046	(3-Me2N)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1047	(2-Me2N)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1048	(4-MeOCO)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1049	(3-MeOCO)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1050	(2-MeOCO)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1051	(4-CN)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1052	(3-CN)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1053	(2CN)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1054	(4NO2)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1055	(3NO2)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1056	(2NO2)C6H4C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1057	(4-Cl)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1058	(3-Cl)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1059	(2-Cl)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1060	(4-F)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1061	(3-F)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1062	(2-F)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1063	(4-Me)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1064	(3-Me)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1065	(2-Me)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1066	(4-MeO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1067	(3-MeO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1068	(2-MeO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1069	(4-Me2N)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1070	(3-Me2N)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1071	(2-Me2N)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1072	(4-MeOCO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1073	(3-MeOCO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1074	(2-MeOCO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1075	(4-CN)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1076	(3-CN)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1077	(2CN)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1078	(4NO2)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1079	(3NO2)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1080	(2NO2)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3

表 116



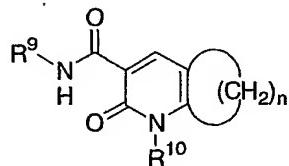
化合物番号	R9	R10	n
9-1081	(4-Cl)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1082	(3-Cl)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1083	(2-Cl)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1084	(4-F)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1085	(3-F)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1086	(2-F)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1087	(4-Me)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1088	(3-Me)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1089	(2-Me)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1090	(4-MeO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1091	(3-MeO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1092	(2-MeO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1093	(4-Me2N)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1094	(3-Me2N)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1095	(2-Me2N)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1096	(4-MeOCO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1097	(3-MeOCO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1098	(2-MeOCO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1099	(4-CN)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1100	(3-CN)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1101	(2CN)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1102	(4NO <sub>2</sub> )C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1103	(3NO <sub>2</sub> )C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1104	(2NO <sub>2</sub> )C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	4
9-1105	(4-Cl)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1106	(3-Cl)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1107	(2-Cl)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1108	(4-F)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1109	(3-F)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1110	(2-F)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1111	(4-Me)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1112	(3-Me)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1113	(2-Me)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1114	(4-MeO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1115	(3-MeO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1116	(2-MeO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1117	(4-Me2N)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1118	(3-Me2N)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1119	(2-Me2N)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1120	(4-MeOCO)C6H4C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5

表 117



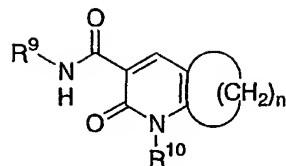
化合物番号	R9	R10	n
9-1121	(3-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5
9-1122	(2-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5
9-1123	(4-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5
9-1124	(3-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5
9-1125	(2CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5
9-1126	(4NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5
9-1127	(3NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5
9-1128	(2NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5
9-1129	(4-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1130	(3-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1131	(2-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1132	(4-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1133	(3-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1134	(2-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1135	(4-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1136	(3-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1137	(2-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1138	(4-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1139	(3-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1140	(2-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1141	(4-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1142	(3-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1143	(2-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1144	(4-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1145	(3-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1146	(2-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1147	(4-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1148	(3-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1149	(2CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1150	(4NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1151	(3NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1152	(2NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	6
9-1153	(4-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	3
9-1154	(3-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	3
9-1155	(2-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	3
9-1156	(4-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	3
9-1157	(3-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	3
9-1158	(2-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	3
9-1159	(4-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	3
9-1160	(3-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	n-Bu	3

表 118



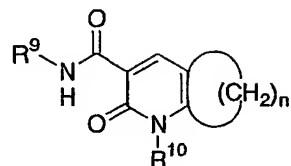
化合物番号	R9	R10	n
9-1161	(2-Me)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1162	(4-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1163	(3-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1164	(2-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1165	(4-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1166	(3-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1167	(2-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1168	(4-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1169	(3-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1170	(2-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1171	(4-CN)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1172	(3-CN)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1173	(2CN)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1174	(4NO2)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1175	(3NO2)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1176	(2NO2)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	3
9-1177	(4-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1178	(3-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1179	(2-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1180	(4-F)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1181	(3-F)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1182	(2-F)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1183	(4-Me)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1184	(3-Me)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1185	(2-Me)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1186	(4-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1187	(3-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1188	(2-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1189	(4-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1190	(3-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1191	(2-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1192	(4-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1193	(3-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1194	(2-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1195	(4-CN)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1196	(3-CN)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1197	(2CN)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1198	(4NO2)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1199	(3NO2)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4
9-1200	(2NO2)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	4

表 119



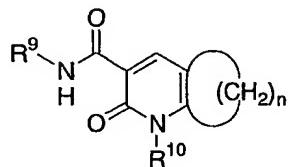
化合物番号	R9	R10	n
9-1201	(4-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1202	(3-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1203	(2-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1204	(4-F)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1205	(3-F)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1206	(2-F)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1207	(4-Me)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1208	(3-Me)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1209	(2-Me)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1210	(4-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1211	(3-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1212	(2-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1213	(4-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1214	(3-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1215	(2-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1216	(4-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1217	(3-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1218	(2-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1219	(4-CN)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1220	(3-CN)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1221	(2CN)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1222	(4NO2)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1223	(3NO2)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1224	(2NO2)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	5
9-1225	(4-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1226	(3-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1227	(2-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1228	(4-F)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1229	(3-F)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1230	(2-F)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1231	(4-Me)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1232	(3-Me)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1233	(2-Me)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1234	(4-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1235	(3-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1236	(2-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1237	(4-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1238	(3-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1239	(2-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1240	(4-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6

表 120



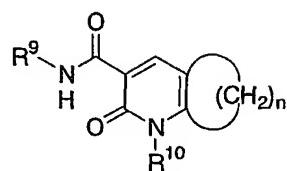
化合物番号	R9	R10	n
9-1241	(3-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1242	(2-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1243	(4-CN)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1244	(3-CN)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1245	(2CN)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1246	(4NO2)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1247	(3NO2)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1248	(2NO2)C6H4CH2C(Me2)-	n-Bu	6
9-1249	(4-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1250	(3-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1251	(2-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1252	(4-F)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1253	(3-F)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1254	(2-F)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1255	(4-Me)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1256	(3-Me)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1257	(2-Me)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1258	(4-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1259	(3-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1260	(2-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1261	(4-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1262	(3-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1263	(2-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1264	(4-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1265	(3-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1266	(2-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1267	(4-CN)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1268	(3-CN)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1269	(2CN)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1270	(4NO2)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1271	(3NO2)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1272	(2NO2)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	3
9-1273	(4-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1274	(3-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1275	(2-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1276	(4-F)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1277	(3-F)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1278	(2-F)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1279	(4-Me)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1280	(3-Me)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4

表 121



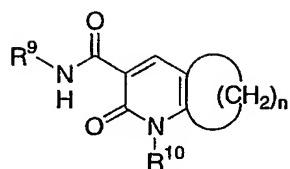
化合物番号	R9	R10	n
9-1281	(2-Me)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1282	(4-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1283	(3-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1284	(2-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1285	(4-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1286	(3-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1287	(2-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1288	(4-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1289	(3-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1290	(2-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1291	(4-CN)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1292	(3-CN)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1293	(2CN)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1294	(4NO2)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1295	(3NO2)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1296	(2NO2)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	4
9-1297	(4-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1298	(3-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1299	(2-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1300	(4-F)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1301	(3-F)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1302	(2-F)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1303	(4-Me)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1304	(3-Me)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1305	(2-Me)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1306	(4-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1307	(3-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1308	(2-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1309	(4-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1310	(3-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1311	(2-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1312	(4-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1313	(3-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1314	(2-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1315	(4-CN)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1316	(3-CN)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1317	(2CN)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1318	(4NO2)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1319	(3NO2)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5
9-1320	(2NO2)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	5

表 122



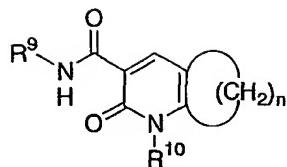
化合物番号	R9	R10	n
9-1321	(4-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1322	(3-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1323	(2-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1324	(4-F)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1325	(3-F)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1326	(2-F)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1327	(4-Me)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1328	(3-Me)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1329	(2-Me)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1330	(4-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1331	(3-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1332	(2-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1333	(4-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1334	(3-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1335	(2-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1336	(4-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1337	(3-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1338	(2-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1339	(4-CN)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1340	(3-CN)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1341	(2CN)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1342	(4NO2)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1343	(3NO2)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1344	(2NO2)C6H4CH2C(Me2)-	Bnzy1	6
9-1345	(4-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1346	(3-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1347	(2-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1348	(4-F)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1349	(3-F)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1350	(2-F)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1351	(4-Me)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1352	(3-Me)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1353	(2-Me)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1354	(4-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1355	(3-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1356	(2-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1357	(4-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1358	(3-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1359	(2-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3
9-1360	(4-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	3

表 123



化合物番号	R9	R10	n
9-1361	(3-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	3
9-1362	(2-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	3
9-1363	(4-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	3
9-1364	(3-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	3
9-1365	(2CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	3
9-1366	(4NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	3
9-1367	(3NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	3
9-1368	(2NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	3
9-1369	(4-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1370	(3-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1371	(2-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1372	(4-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1373	(3-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1374	(2-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1375	(4-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1376	(3-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1377	(2-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1378	(4-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1379	(3-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1380	(2-MeO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1381	(4-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1382	(3-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1383	(2-Me <sub>2</sub> N)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1384	(4-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1385	(3-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1386	(2-MeOCO)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1387	(4-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1388	(3-CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1389	(2CN)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1390	(4NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1391	(3NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1392	(2NO <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	4
9-1393	(4-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5
9-1394	(3-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5
9-1395	(2-Cl)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5
9-1396	(4-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5
9-1397	(3-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5
9-1398	(2-F)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5
9-1399	(4-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5
9-1400	(3-Me)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )-	4-pyridyl-CH <sub>2</sub> -	5

表 124

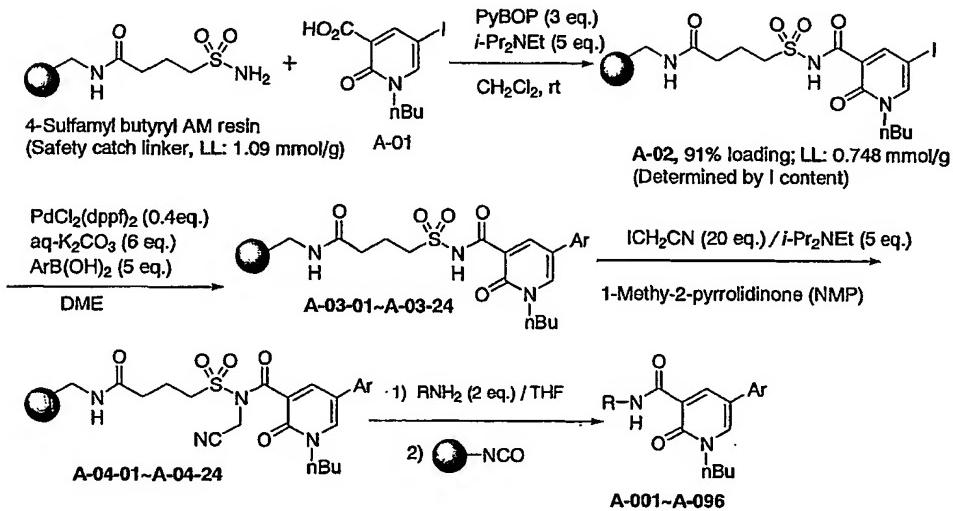


化合物番号	R9	R10	n
9-1401	(2-Me)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1402	(4-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1403	(3-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1404	(2-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1405	(4-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1406	(3-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1407	(2-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1408	(4-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1409	(3-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1410	(2-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1411	(4-CN)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1412	(3-CN)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1413	(2CN)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1414	(4NO2)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1415	(3NO2)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1416	(2NO2)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	5
9-1417	(4-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1418	(3-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1419	(2-Cl)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1420	(4-F)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1421	(3-F)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1422	(2-F)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1423	(4-Me)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1424	(3-Me)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1425	(2-Me)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1426	(4-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1427	(3-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1428	(2-MeO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1429	(4-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1430	(3-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1431	(2-Me2N)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1432	(4-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1433	(3-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1434	(2-MeOCO)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1435	(4-CN)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1436	(3-CN)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1437	(2CN)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1438	(4NO2)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1439	(3NO2)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6
9-1440	(2NO2)C6H4CH2C(Me2)-	4-pyridyl-CH2-	6

さらに本発明化合物を以下に示すように固相反応を用いて行い、パラレル合成した。なお、確認はマススペクトルで行い、各化合物の生物試験を行った。

<ライブラリーA>

- 5 1-ブチル-2-オキソ-5-アリール-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸 アミド誘導体 (Combi-A)のコンビナトリアル合成



- a) レジン A-02 の合成 : 4-スルファミルブチリル AM レジン (3.9 g) の塩化メチレン (80 ml) 溶液に, 室温で 1-ブチル-5-ヨード-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸 (A-01) (4.1 g), 及び *N,N*-ジイソプロピルエチルアミン (3.7 ml) を加えた。10 分攪拌した後に PyBOP (6.6 g) を室温で加え, さらに 18 時間攪拌した。レジンを濾取し, 水, THF, 塩化メチレン, 及びエーテルで順次洗浄することによりレジン (A-02) [5.2 g, 92% (ヨウ素元素分析)]を得た。
- b) レジン(A-03-01~A-03-24)の合成 : レジン A-02 (150 mg) を 24 個のフラスコに分量し, それぞれに DME (2.5 ml),  $PdCl_2(dppf)$  (35 mg), アリールホウ酸 (5 当量), 及び炭酸カリウム水溶液 (2M, 0.34 ml) を加えた。80 °Cで 18 時間攪拌した後, レジンを濾取し, 水, THF, *N*-メチルピロリドン, 塩化メチレン, 及びエーテルで順次洗浄することによりレジン A-03-01~A-03-24を得た。

- c) レジン A-04-01～A-04-24 の合成：レジン A-03-01～A-03-24 に *N*-メチルピロリドン (2.0 ml), ヨードアセトニトリル (0.16 ml), *N,N*-ジイソプロピルエチルアミン (0.1 ml) を室温で加えた。24 時間攪拌した後、レジンを濾取し、*N*-メチルピロリドン、塩化メチレン、及びエーテルで順次洗浄することによりレジン A-04-01～A-04-24 を得た。
- d) 1-ブチル-2-オキソ-5-アリール-1,2-ジヒドロビリジン-3-カルボン酸 アミド誘導体 A-05-01～A-05-96 の合成：レジン A-04-01～A-04-24 のそれぞれをさらに 4 分割し、96 穴プレートに分量した。それそれに THF (0.7 ml) を加えた後に、アミンを 24 種類のレジンにそれぞれ加えた。24 時間振とうした後に高分子固定化イソシアネート樹脂を加え、さらに 3 時間振とうした。レジンを濾別し、塩化メチレンで洗浄し濾液を減圧下で留去することにより 1-ブチル-2-オキソ-5-アリール-1,2-ジヒドロビリジン-3-カルボン酸 アミド誘導体 A-001～A-096 を得た。

以下に A-001～A-096 の構造を示す。

表 125

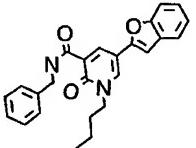
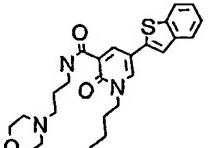
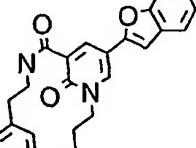
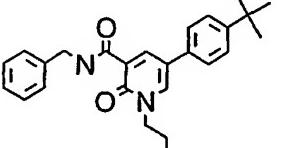
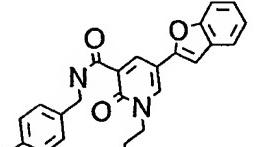
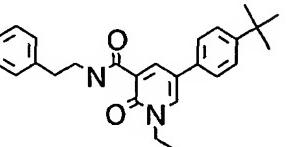
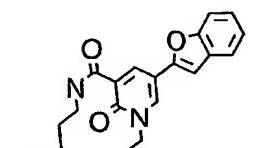
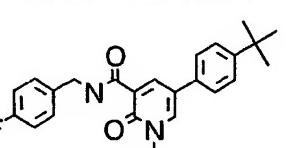
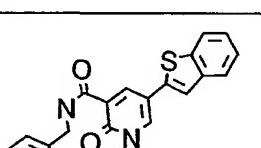
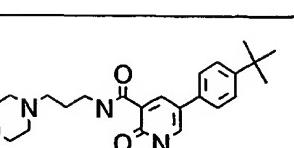
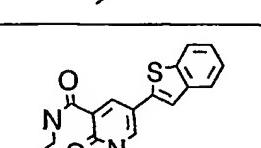
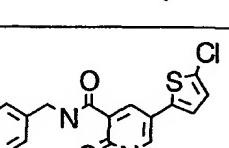
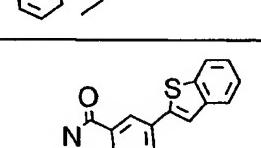
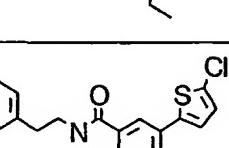
No	構造	No	構造
A-001		A-008	
A-002		A-009	
A-003		A-010	
A-004		A-011	
A-005		A-012	
A-006		A-013	
A-007		A-014	

表 126

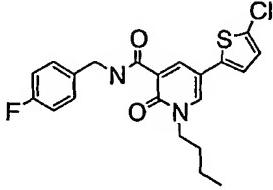
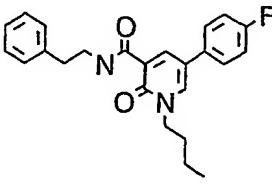
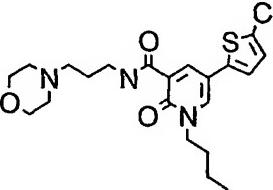
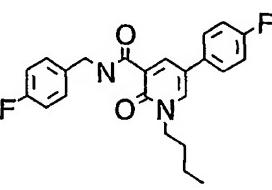
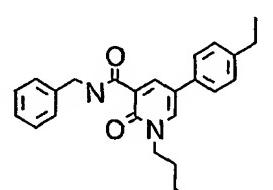
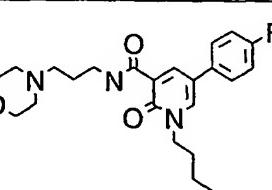
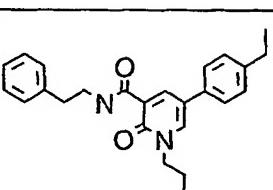
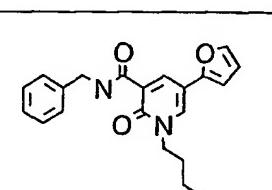
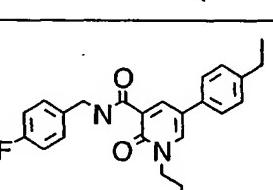
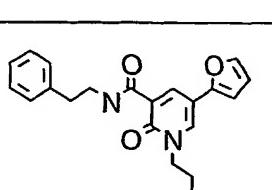
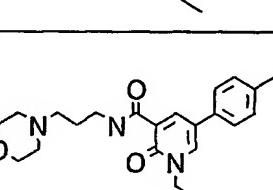
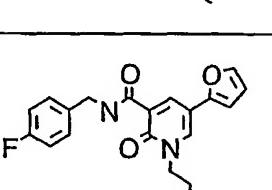
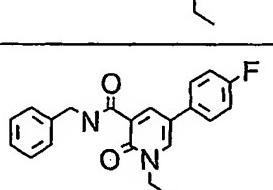
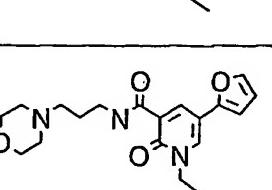
No	構造	No	構造
A-015		A-022	
A-016		A-023	
A-017		A-024	
A-018		A-025	
A-019		A-026	
A-020		A-027	
A-021		A-028	

表 127

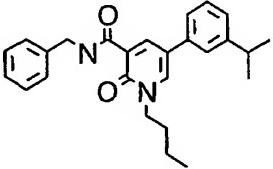
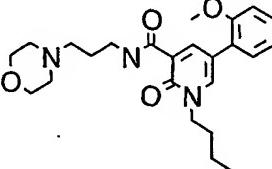
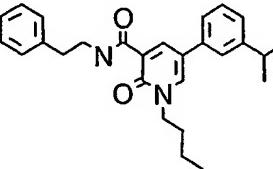
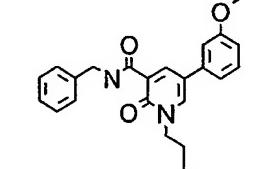
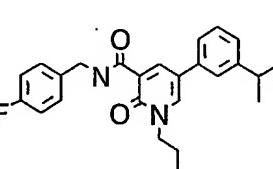
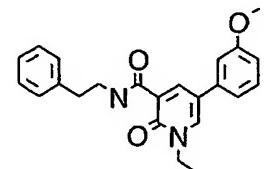
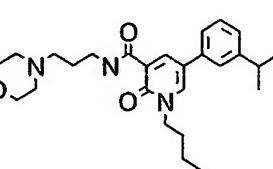
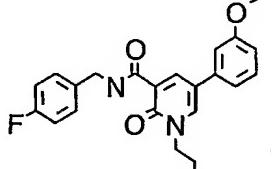
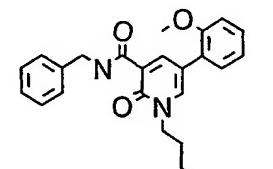
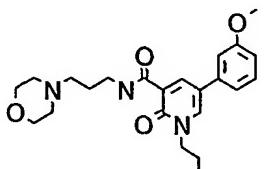
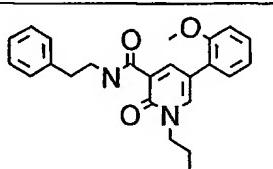
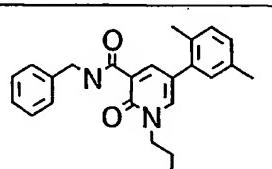
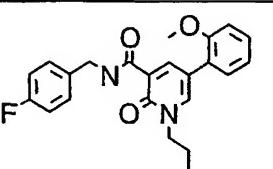
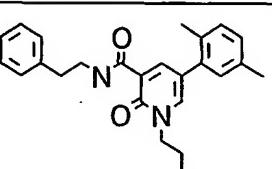
No	構造	No	構造
A-029		A-036	
A-030		A-037	
A-031		A-038	
A-032		A-039	
A-033		A-040	
A-034		A-041	
A-035		A-042	

表 128

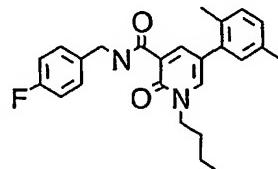
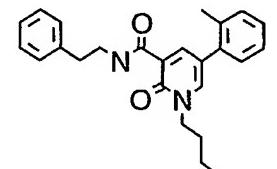
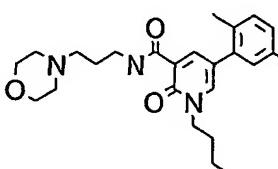
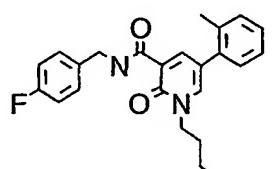
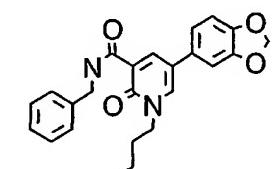
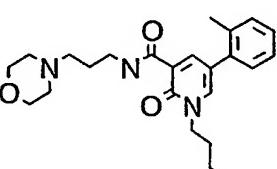
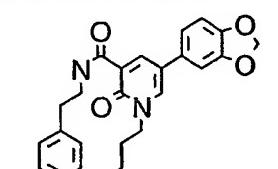
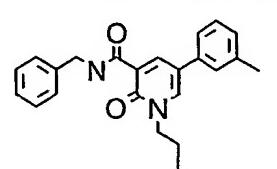
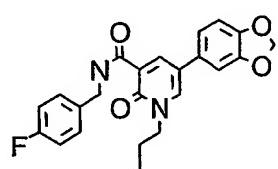
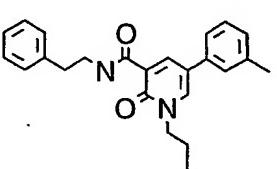
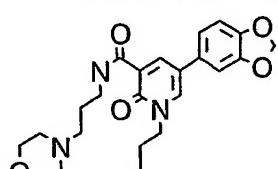
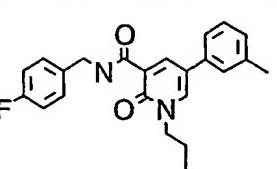
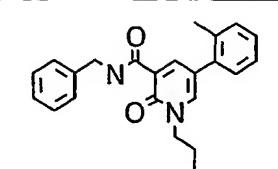
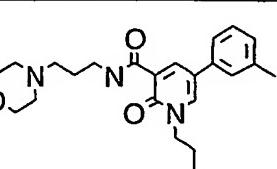
No	構造	No	構造
A-043		A-050	
A-044		A-051	
A-045		A-052	
A-046		A-053	
A-047		A-054	
A-048		A-055	
A-049		A-056	

表 129

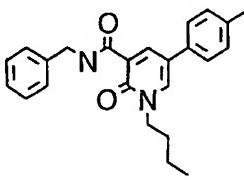
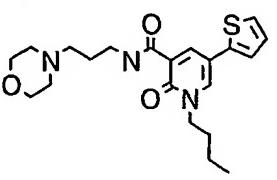
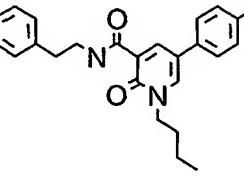
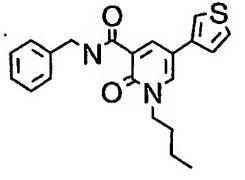
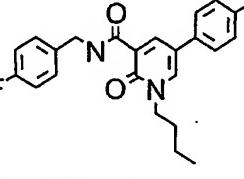
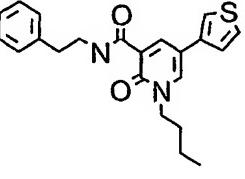
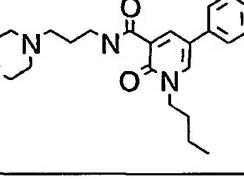
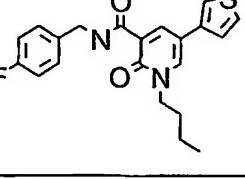
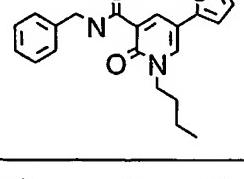
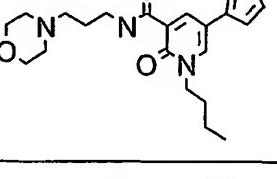
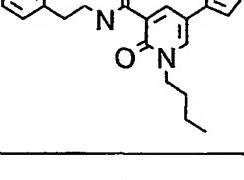
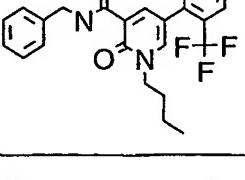
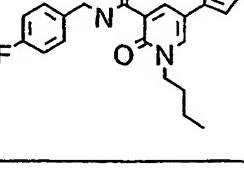
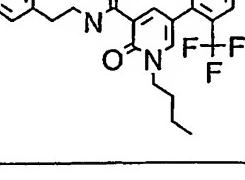
No	構造	No	構造
A-057		A-064	
A-058		A-065	
A-059		A-066	
A-060		A-067	
A-061		A-068	
A-062		A-069	
A-063		A-070	

表 130

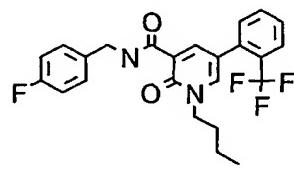
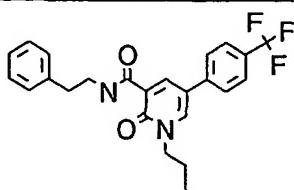
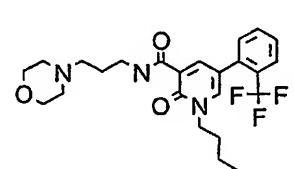
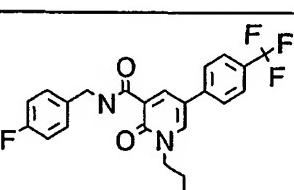
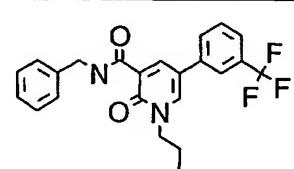
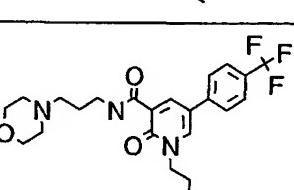
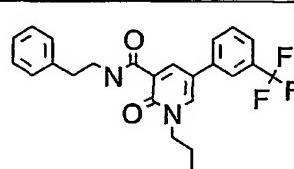
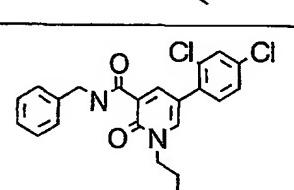
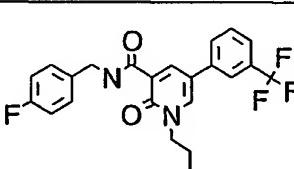
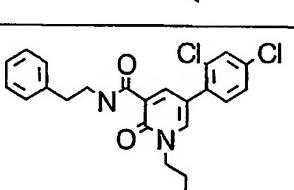
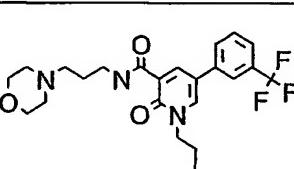
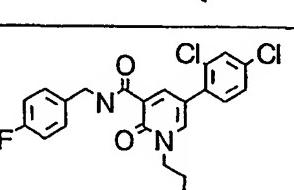
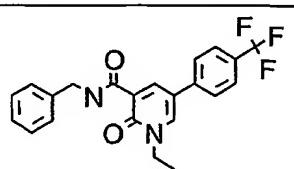
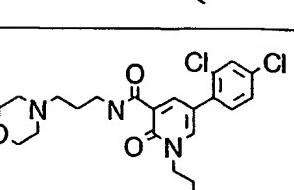
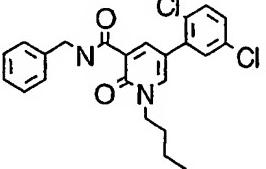
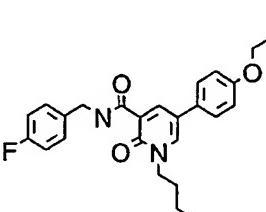
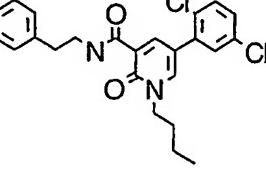
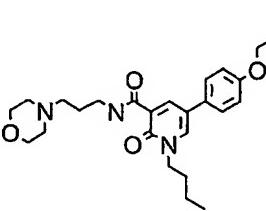
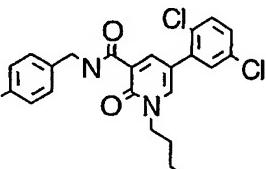
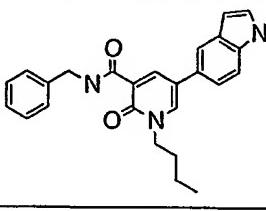
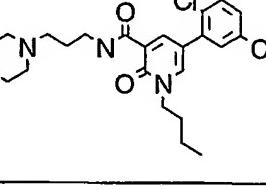
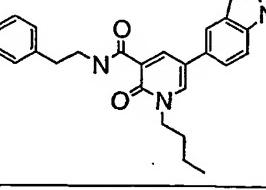
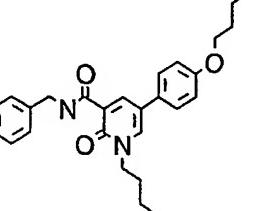
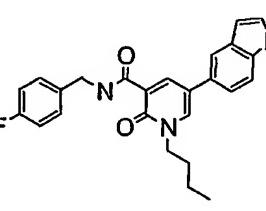
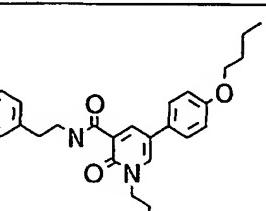
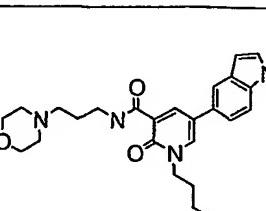
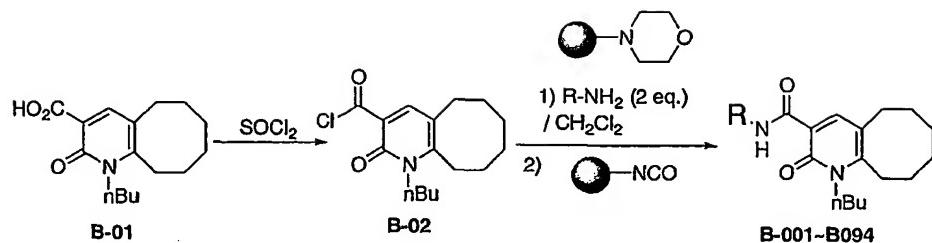
No	構造	No	構造
A-071		A-078	
A-072		A-079	
A-073		A-080	
A-074		A-081	
A-075		A-082	
A-076		A-083	
A-077		A-084	

表 131

No	構造	No	構造
A-085		A-091	
A-086		A-092	
A-087		A-093	
A-088		A-094	
A-089		A-095	
A-090		A-096	

## &lt;ライブライーB&gt;



a) 1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8,9,10-オクタヒドロ-シクロオクタ[b]ピリジン-3-

5 カルボニルクロリド (B-02)の合成

1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8,9,10-オクタヒドロ-シクロオクタ[b]ピリジン-3-

カルボン酸 (B-01) (416 mg、1.50 mmol)をトルエン (15 ml)に溶解し、塩化チオニル (328  $\mu\text{l}$ 、4.50 mmol)を加え、65°Cで20分反応させる。この反応液を減圧濃縮することにより、1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8,9,10-オクタヒドロ-シクロオクタ [b] ピリジン-3-カルボニルクロリド(B-02)を得た。

b) 1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8,9,10-オクタヒドロ-シクロオクタ[b]ピリジン-3-

カルボン酸 アミド誘導体 (B-03-01～B-03-94)の合成

高分子固定化 *N*-メチルモルホリン樹脂(1.93 mmol/g)を96穴反応プレートに15

mgずつ分量したのち、アミン( $\text{R-NH}_2$ )の50 mM 塩化メチレン溶液を300  $\mu\text{l}$ 、塩化メチレン(700  $\mu\text{l}$ )、1-ブチル-2-オキソ-1,2,5,6,7,8,9,10-オクタヒドロ-シクロオクタ [b] ピリジン-3-カルボニルクロリド(B-02)の30 mg/ml 塩化メチレン溶液を100  $\mu\text{l}$ を996穴反応プレートにそれぞれ加えた。

室温で15時間振とうした後に高分子固定化イソシアネート樹脂を加え、さらに

3時間振とうした。レジンを濾別し、塩化メチレンで洗浄し濾液を減圧下で留去す

20 ることによりB-001～B-094を得た。

以下にB-001～B-094の構造を示す。

表 132

No	構造	No	構造
B-001		B-008	
B-002		B-009	
B-003		B-010	
B-004		B-011	
B-005		B-012	
B-006		B-013	
B-007		B-014	

表 133

No	構造	No	構造
B-015		B-022	
B-016		B-023	
B-017		B-024	
B-018		B-025	
B-019		B-026	
B-020		B-027	
B-021		B-028	

表 1 3 4

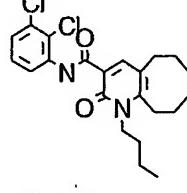
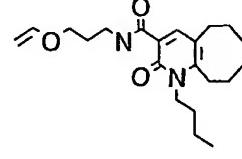
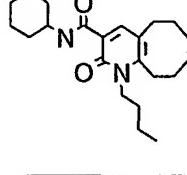
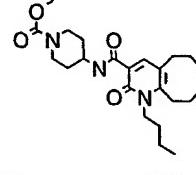
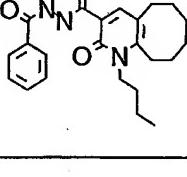
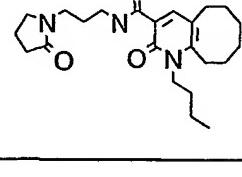
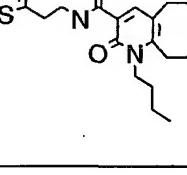
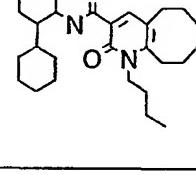
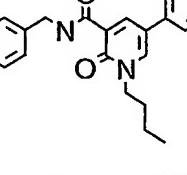
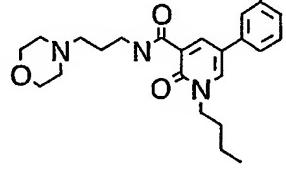
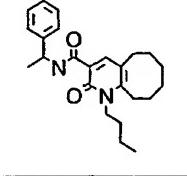
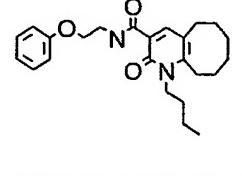
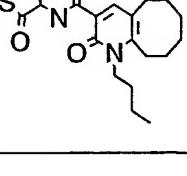
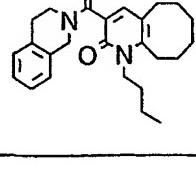
No	構造	No	構造
B-029		B-036	
B-030		B-037	
B-031		B-038	
B-032		B-039	
B-033		B-040	
B-034		B-041	
B-035		B-042	

表 135

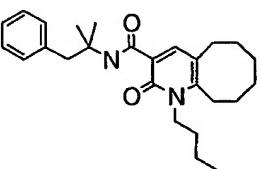
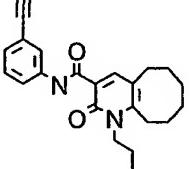
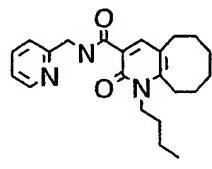
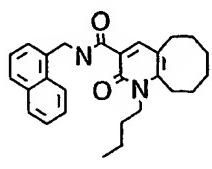
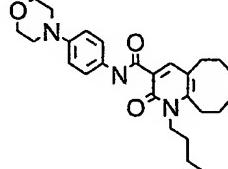
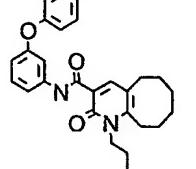
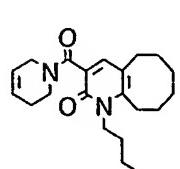
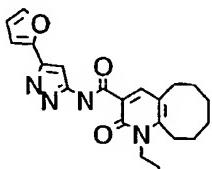
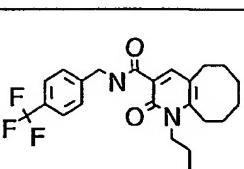
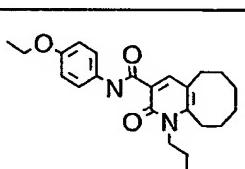
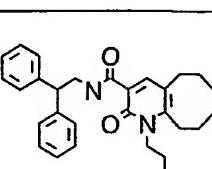
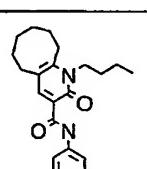
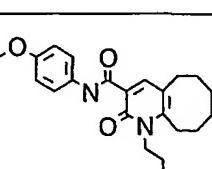
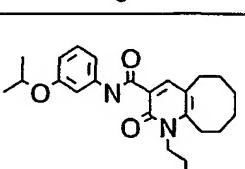
No	構造	No	構造
B-043		B-050	
B-044		B-051	
B-045		B-052	
B-046		B-053	
B-047		B-054	
B-048		B-055	
B-049		B-056	

表 136

No	構造	No	構造
B-057		B-064	
B-058		B-065	
B-059		B-066	
B-060		B-067	
B-061		B-068	
B-062		B-069	
B-063		B-070	

表 137

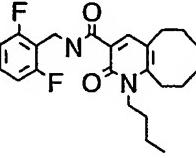
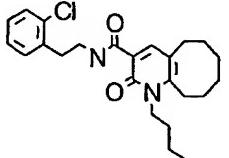
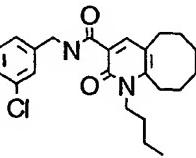
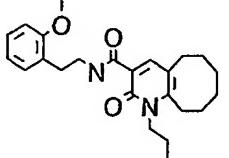
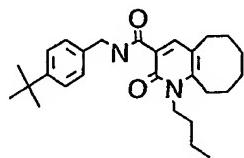
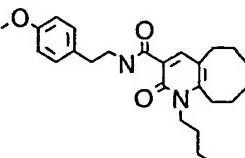
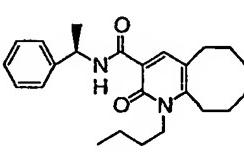
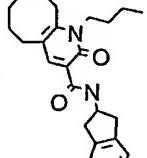
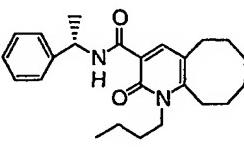
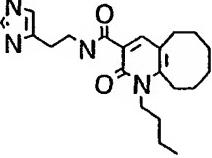
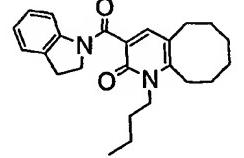
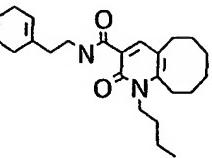
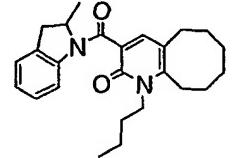
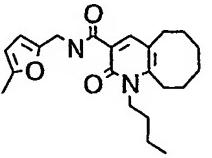
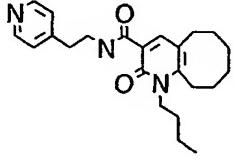
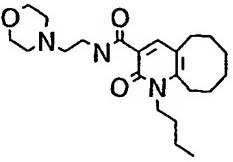
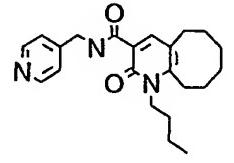
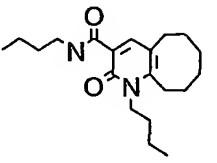
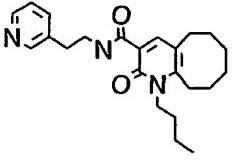
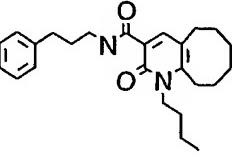
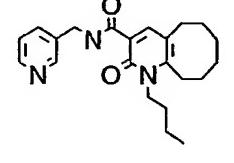
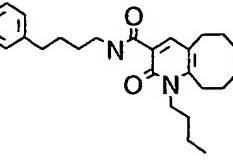
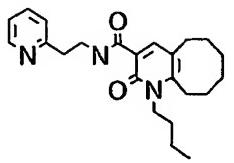
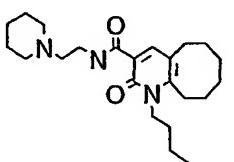
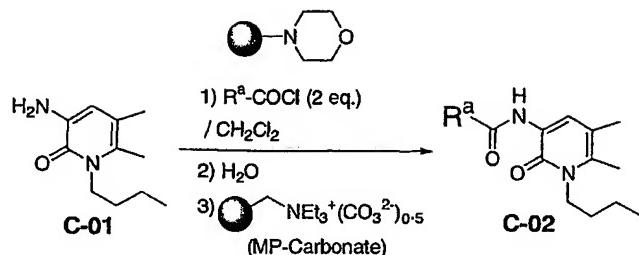
No	構造	No	構造
B-071		B-078	
B-072		B-079	
B-073		B-080	
B-074		B-081	
B-075		B-082	
B-076		B-083	
B-077		B-084	

表 138

No	構造	No	構造
B-085		B-091	
B-086		B-092	
B-087		B-093	
B-088		B-094	
B-089			
B-090			

&lt;ライブラリーC&gt;



a) *N*-(1-ブチル-5,6-ジメチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロ-ピリジン-3-イル) アルキルアミド誘導体 (C-02-01~C-02-19) の合成

5 高分子固定化 *N*-メチルモルホリン樹脂(3.0 mmol/g)を48穴反応プレートに50mgずつ分量したのち、3-アミノ-1-ブチル-5,6-ジメチル-1*H*-ピリジン-2-オン(C-01)の25 mM 塩化メチレン溶液を2 ml、酸クロリド(R-COCl, 0.10 mmol)を順に48穴反応プレートにそれぞれ加えた。

10 室温で15時間振とうした後に高分子固定化カーボナート樹脂(MP-Carbonate)を加え、さらに12時間振とうした。レジンを濾別し、塩化メチレンで洗浄し濾液を減圧下で留去することにより C-02-01~C-02-19を得た。

表 139

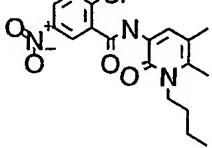
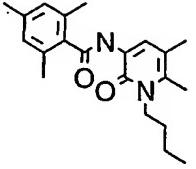
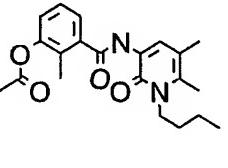
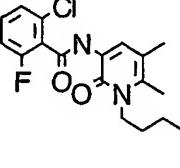
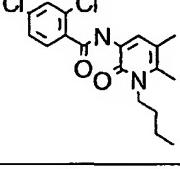
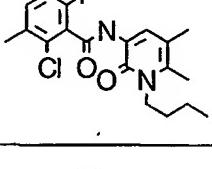
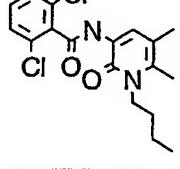
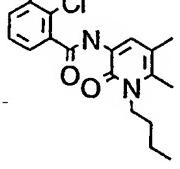
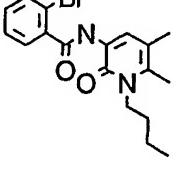
No	構造	No	構造
C-001		C-008	
C-002		C-009	
C-003		C-010	
C-004		C-011	
C-005		C-012	
C-006		C-013	
C-007		C-014	

表 140

No	構造
C-015	
C-016	
C-017	
C-018	
C-019	

なお、表 125～140において、アミド結合の窒素上の水素は省略している。

#### 試験例

5 上記の本発明化合物の試験例を以下に示す。

##### 試験例 1 ヒト CB2 受容体結合阻害実験

ヒト CB2 受容体をコードする cDNA 配列 (Munro 等, Nature, 1993, 365, 61-65) を、動物細胞用発現ベクターである pSVL SV40 Late Promoter Expression

Vector (Amersham Pharmacia Biotech 社) のプロモータ一下流域に順方向に挿入した。得られた発現ベクターを LipofectAMINE 試薬 (Gibco BRL 社) を用いて、宿主細胞 CHO に使用説明書にしたがってトランスフェクションし、CB2 受容体安定発現細胞を得た。

- 5 CB2 受容体を発現させた CHO 細胞から調製した膜標品を、被検化合物及び 38,000 dpm の [<sup>3</sup>H]CP55940 (終濃度 0.5 nM : NEN Life Science Products 社製) とともに、アッセイ緩衝液 (0.5% 牛血清アルブミンを含む 50 mM Tris-HCl 緩衝液 (pH 7.4) 、 1 mM EDTA、 3 mM MgCl<sub>2</sub>) 中で、 25°C、 2 時間インキュベーションした後、 1% ポリエチレンイミン処理したグラスフィルター GF/C にて濾過した。 0.1% BSA を含む 50 mM Tris-HCl 緩衝液 (pH 7.4) にて洗浄後、液体シンチレーションカウンターにてグラスフィルター上の放射活性を求めた。 非特異的結合は 10 μM WIN55212-2 (US 5081122 記載のカンナビノイド受容体アゴニスト、 Research Biochemicals International 社製) 存在下で測定し、特異的結合に対する被検化合物の 50% 阻害濃度 (IC<sub>50</sub> 値) を求めた。
- 10 ヒト CB1 受容体に対する結合実験は、 CB1 受容体を安定発現する CHO 細胞を 上記と同じ方法で作製し、その膜画分を用いて行った。これらの結合実験の結果、 得られた被検化合物の各ヒトカンナビノイド受容体に対する K<sub>i</sub> 値を表に示した。 表に示したとおり、本発明の一連の化合物は、 CB2 受容体への CP55940 (US 4371720 記載のカンナビノイド受容体アゴニスト) の結合を阻害した。

表 141

化合物	Ki (nM)		化合物	Ki (nM)	
	CB1受容体	CB2受容体		CB1受容体	CB2受容体
2-004	nt	101	4-062	>5000	4
3-010	nt	57	4-101	890	1.5
3-038	1252	12	4-102	908	1.6
4-001	2851	28	4-104	54	6
4-002	746	17	4-105	91	2.1
4-003	680	44	4-301	1769	8
4-052	1497	24	4-302	>5000	10
4-053	254	6	4-310	512	9
4-054	482	6	5-005	391	16
4-056	551	8	5-006	390	14
4-061	124	2.5			

n.t.: not tested

## 5 試験例 2 ヒト CB2 受容体を介する cAMP 生成阻害実験

ヒト CB2 受容体を発現させた CHO 細胞に、被検化合物を添加し 15 分間インキュベーションの後、フォルスコリン（終濃度 4  $\mu$ M、SIGMA 社）を加えて 20 分間インキュベーションした。1N HCl を添加して反応を停止させた後、上清中の cAMP 量を Amersham Pharmacia Biotech 社製の EIA kit を用いて測定した。フォルスコリン刺激による cAMP 生成をフォルスコリン無刺激に対して 100%とし、50%の抑制作用を示す被検化合物の濃度 ( $IC_{50}$  値) を求めた。この結果得られた被検化合物の  $IC_{50}$  値を表に示す。表に示すとおり、本発明化合物は、CB2 受容体に対してアゴニスト作用を示した。

なお、同様に試験することにより、アンタゴニスト作用についても試験することができる。

表 142

化合物	$IC_{50}$ (nM)
3-038	28.6
4-001	64.2
4-053	7.9
4-054	4.2
4-056	4.3
4-061	2.3
4-062	1.3
4-101	1.4
4-102	1.7
4-104	9.8

- なお、本発明化合物は以下に示すインビボでの試験により、抗炎症効果を確認することができる。
- 試験 ヒツジ赤血球(SRBC)誘発遅延型過敏反応(DTH)モデル実験
- 雌性 ddY マウス(7週令)を用い、 $10^7$ 個の SRBC をマウス左後肢足蹠皮内(40 ml)に注射することにより感作する。感作から 5 日後に  $10^8$  個の SRBC をマウス右後肢足蹠皮内(40 ml)に注射することにより DTH 反応を惹起する。カンナビノイド 2 型受容体親和性化合物である本発明化合物を 0.6%アラビアゴム溶液に懸濁し、DTH 反応惹起 1 時間前および 5 時間後に経口投与(10 ml/kg)する。SRBC 注射 24 時間後に左右後肢の容積を水置換法により測定し、右足容積と左足容積の差を求めるこにより足浮腫容量を算出して DTH 反応の指標とする。なお、統計的検定は Welch の t 検定法により行なうことができ、 $P < 0.05$  のとき有意差ありと判定することにより、本発明化合物の抗炎症効果を確認することができる。

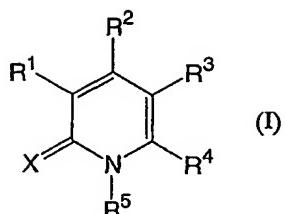
#### 産業上の利用可能性

本発明化合物は、カンナビノイド 2 型受容体に結合し、カンナビノイド 2 型受

容体アンタゴニスト作用またはカンナビノイド2型受容体アゴニスト作用を示す。  
従って、カンナビノイド2型受容体が関与する疾患に対して治療又は予防の目的  
で使用することができる。

## 請求の範囲

## 1. 式 (I) :



- 5 (式中、R<sup>1</sup>は水素、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコ  
キカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換  
されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニル  
オキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニト  
ロ又は式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup> (式中、Y<sup>1</sup>及びY<sup>3</sup>はそれぞれ独立して単結  
合又は置換されていてもよいアルキレンであり；Y<sup>2</sup>は単結合、-O-、-O-C  
(=O)-、-O-C(=O)-O-、-O-C(=O)-NR<sup>b</sup>-、-O-SO  
z-、-NR<sup>b</sup>-、-NR<sup>b</sup>-C(=O)-、-NR<sup>b</sup>-SO<sub>2</sub>-、-NR<sup>b</sup>-C(=N  
H)-、-NR<sup>b</sup>-C(=O)-O-、-NR<sup>b</sup>-C(=O)-NR<sup>b</sup>-、-N  
R<sup>b</sup>-C(=O)-NR<sup>b</sup>-SO<sub>2</sub>-、-NR<sup>b</sup>-C(=S)-、-NR<sup>b</sup>-C(=S)  
-NR<sup>b</sup>-、-NR<sup>b</sup>-SO<sub>2</sub>-NR<sup>b</sup>-、-NR<sup>b</sup>-C(=NH)-NR<sup>b</sup>-、  
-S-、-SO<sub>2</sub>-O-、-SO<sub>2</sub>-NR<sup>b</sup>-、-SO<sub>2</sub>-NR<sup>b</sup>-C(=O)-N  
R<sup>b</sup>-、-C(=O)-O-、-C(=O)-NR<sup>b</sup>-、-C(=O)-NR<sup>b</sup>-  
C(=O)-、-C(=O)-NR<sup>b</sup>-C(=S)-、-C(=S)-NR<sup>b</sup>-、  
-C(=S)-NR<sup>b</sup>-C(=O)-、-C(=NH)-NR<sup>b</sup>-、-C(=O)  
-、-C(=O)-NR<sup>b</sup>-C(=NR<sup>b</sup>) -又は-C(=O)-NR<sup>b</sup>-NR<sup>b</sup>  
-であり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニ  
ル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよい炭素環式基、置換  
されていてもよい複素環式基又はアシルであり；R<sup>b</sup>はそれぞれ独立して水素、置  
換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されてい

てもよいアルキニル、置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基、アシル、ヒドロキシ又はアルコキシである)で示される基であり; R<sup>2</sup>は水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式: -Y<sup>4</sup>-R<sup>o</sup> (式中、Y<sup>4</sup>は単結合、-O-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-NH-、-C(=O)-、-CH<sub>2</sub>-、-C(=O)-NH-又は-NH-C(=O)-であり; R<sup>o</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である)で示される基であり;

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>はそれぞれ独立して、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式: -Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup> (式中、Y<sup>5</sup>は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、-O-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-NH-、-C(=O)-、-CH<sub>2</sub>-、-C(=O)-NH-E-又は-NH-C(=O)-であり; Eは単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり; R<sup>d</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である)で示される基であり;

R<sup>5</sup>は水素、ヘテロ原子及び/又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよいアルキル又は式: -Y<sup>6</sup>-R<sup>e</sup> (式中、Y<sup>6</sup>は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、-O-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-NH-、-C(=O)-、-C(=O)-NH-E-又は-NH-C(=O)-であり; Eは単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり; R<sup>e</sup>

は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である)で示される基であり;

又は、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>の組合わせ、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>の組合わせ、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>の組合わせ

のいずれか一つの組合わせが一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び  
5 /又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成していて  
もよく;

XはS又はOである;

但し、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共にアルコキシでジ置換され  
たベンゼン環を形成し、かつR<sup>5</sup>が水素又はメチルである場合を除く。)で示され

10 化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物を有効  
成分として含有するカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物。

2. R<sup>5</sup>がヘテロ原子及び/又は不飽和結合が介在していてもよい置換され  
ていてもよい炭素数2以上のアルキル又は式：-Y<sup>6</sup>-R<sup>a</sup>(式中、Y<sup>6</sup>及びR<sup>a</sup>  
は請求の範囲第1項と同意義である)で示される基である請求の範囲第1項記載  
15 のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物。

3. R<sup>5</sup>がヘテロ原子及び/又は不飽和結合が介在していてもよい置換され  
ていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式：-Y<sup>6</sup>-R<sup>a</sup>(式中、Y<sup>6</sup>は置換さ  
れていてもよいアルキレンであり; R<sup>a</sup>は置換されていてもよいアリール、置換さ  
れていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換  
20 されていてもよいヘテロサイクルである)で示される基である請求の範囲第2項  
記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物。

4. R<sup>1</sup>が式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>(式中、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Y<sup>3</sup>、R<sup>a</sup>及び  
R<sup>b</sup>は請求の範囲第1項と同意義である)で示される基である請求の範囲第1項～  
第3項のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物。

25 5. R<sup>1</sup>が式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>(式中、Y<sup>1</sup>、Y<sup>3</sup>及びR<sup>a</sup>は請求の  
範囲第1項と同意義であり; Y<sup>2</sup>は-O-、-NR<sup>b</sup>-C(=O)-又は-C(=O)  
-NR<sup>b</sup>-であり; R<sup>b</sup>は水素又は置換されていてもよいアルキルである)で

示される基である請求の範囲第4項記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物。

6.  $R^3$ 及び $R^4$ が一緒になっていない請求の範囲第1項～第5項のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物。

5 7.  $R^3$ が水素、置換されていてもよいアルキル、ハロゲン又は式： $-Y^5 - R^d$ （式中、 $Y^5$ は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレンであり； $R^d$ は置換されていてもよいアリール又は置換されていてもよいヘテロアリールである）で示される基であり； $R^4$ が水素又は置換されていてもよいアルキルである（但し、 $R^3$ 及び $R^4$ が同時に水素である場合を除く。）請求の範囲第6項記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物。

8.  $R^3$ 及び $R^4$ が一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環（但し、置換されていてもよいベンゼン環でない）を形成する請求の範囲第1項～第5項のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物。

15 9.  $R^1$ が水素、シアノ、ホルミル、カルボキシ、イソチオシアナト、アミノ、ヒドロキシ、カルバモイル又は式： $-Y^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$ （式中、 $Y^1$ 及び $Y^3$ はそれぞれ独立して単結合又は置換されていてもよいアルキレン（置換基としては、ハロゲン、アルケニレン、ヒドロキシ、アジド、アミノ、アシルアミノ、アルキルスルホニルアミノ、アルケニルオキシカルボニルアミノ、アルコキシカルボニルアミノ、アルケニルアミノ、アリールカルボニルアミノ、ヘテロアリールカルボニルアミノ、アルケニルオキシ、アリールカルボニルオキシ、トリアルキルシリルオキシ、オキソ、メチレン、ハロゲン化アルコキシカルボニルオキシ、ホルミルオキシ及び／又はアシルチオ）であり； $Y^2$ は単結合、 $-O-$ 、 $-O-C(=O)-$ 、 $-O-C(=O)-O-$ 、 $-O-C(=O)-NH-$ 、 $-NH-$ 、 $-NR^b-C(=O)-$ 、 $-NH-C(=O)-O-$ 、 $-NH-C(=O)-NH-$ 、 $-NH-C(=S)-NH-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-O-$ 、 $-SO_2-NH-$ 、 $-SO_2-NH-C(=O)-NH-$ 、 $-C(=O)-O-$ 、 $-C(=O)-$

NR<sup>b</sup>-、-C(=S)-NH-、-C(=O)-NH-C(=O)-、-C(=O)-NH-C(=S)-、-C(=O)-、-C(=O)-NR<sup>b</sup>-C(=NR<sup>b</sup>)-又は-C(=O)-NH-NR<sup>b</sup>-であり；R<sup>a</sup>が置換されていてもよいアルキル（置換基としては、ヒドロキシ及び／又はアラルキル）、アルケニル、置換されていてもよいアリール（置換基としては、カルボキシ、置換されていてもよいアミノ、アルコキシ、アルキルチオ、アルキレンジオキシ、ハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン化アルキル及び／又はハロゲン化アルコキシ）、置換されていてもよいシクロアルキル（置換基としては、アリール及び／又はヒドロキシ）、置換されていてもよいシクロアルケニル（置換基としては、アルケニレン、ヒドロキシ、アルキルスルホニルオキシ、アジド、アミノ及び／又はアシルアミノ）、置換されていてもよいヘテロアリール（置換基としては、オキソ、ヘテロアリール、ハロゲン、アリール及び／又はアルキル）又は置換されていてもよいヘテロサイクル（置換基としては、ハロゲンで置換されていてもよいアリール、アラルキル、アシル、アリールカルボニル、シクロアルキルカルボニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アルキル及び／又はハロゲン化アルキルカルボニル）であり；R<sup>b</sup>が水素、アルキル、アシル、ヒドロキシ及び／又はアルコキシである）で示される基であり；R<sup>2</sup>が水素、アルキル、アルケニル又は式：-Y<sup>4</sup>-R<sup>c</sup>（式中、Y<sup>4</sup>が-O-であり；R<sup>c</sup>がヘテロアリールである）で示される基であり；R<sup>3</sup>が水素、アルキル、ハロゲン又は式：-Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合、アルキニレン又は-C(=O)-NH-アルキレン-であり；R<sup>d</sup>は置換されていてもよいアリール（置換基としては、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ及び／又はハロゲン化アルキル）又は置換されていてもよいヘテロアリール（置換基としては、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ及び／又はハロゲン化アルキル）である）で示される基であり；R<sup>4</sup>が水素、アルキル又は式：-Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合であり；R<sup>d</sup>はアリールである）で示される基であり；

R<sup>5</sup>が水素、ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されてもよい炭素数3以上のアルキル（置換基としては、ハロゲン、ヒドロキシ、アジド、アミノ、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキルスルホニルオキシ、アシルチオ、アシルアミノ、アリールカルボニルアミノ、シクロアルキルカルボニルアミノ、ハロゲン化アルキルカルボニルアミノ、アルキルスルホニルアミノ、アリールスルホニルアミノ、ホルミル、オキソ及び／又はシアノ）又は式：—Y<sup>6</sup>—R<sup>6</sup>（式中、Y<sup>6</sup>はアルキレンであり；R<sup>6</sup>は置換されてもよいアリール、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよいヘテロアリール又は置換されてもよいヘテロサイクルである）で示される基であり；

10 又は、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>が一緒になって、隣接する原子と共に置換されてもよい炭素環（置換基としては、オキソ及び／又はヒドロキシ）を形成するか、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環（置換基としては、アシル、アラルキル、アルケニレン及び／又はアルキレン）を形成するか、又はR<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>が一緒になって、隣接する原子と共に不飽和結合が介在していてもよい置換されてもよい炭素環（置換基としては、アルケニレン）を形成する請求の範囲第1項記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物。

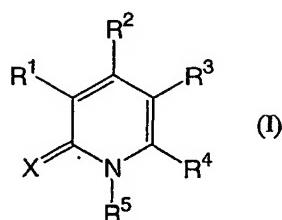
10. 抗炎症剤である請求の範囲第1項～第9項のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物。

20 11. 免疫抑制剤である請求の範囲第1項～第9項のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物。

12. 腎炎治療剤である請求の範囲第1項～第9項のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物。

13. 鎮痛剤である請求の範囲第1項～第9項のいずれかに記載のカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物。

14. 式(I)：



- (式中、R<sup>1</sup>は式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Y<sup>3</sup>及びR<sup>b</sup>は請求の範囲第1項と同意義であり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基又はアシルである）で示される基であり；
- 5 R<sup>2</sup>は水素又は置換されていてもよいアルキルであり；  
R<sup>3</sup>は置換されていてもよいアルキル、ハロゲン又は式：-Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合又はアルキニレンであり；R<sup>d</sup>は請求の範囲第1項と同意義である）で示される基であり；  
R<sup>4</sup>は水素又は置換されていてもよいアルキルであり；
- 10 R<sup>5</sup>はヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式：-Y<sup>6</sup>-R<sup>e</sup>（式中、Y<sup>6</sup>及びR<sup>e</sup>は請求の範囲第1項と同意義である）で示される基であり；  
又は、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい環を形成していてもよく；
- 15 Xは請求の範囲第1項と同意義である；  
但し、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共に置換されていてもよいベンゼン環を形成する場合は、R<sup>1</sup>が式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>が単結合であり；Y<sup>3</sup>が置換されていてもよいアルキレンであり；Y<sup>2</sup>は-NR<sup>b</sup>-C(=O)-、-C(=O)-NR<sup>b</sup>-であり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基であり；R<sup>b</sup>は水素又は置換されていてもよいアルキルである。）で示される基である；  
なお、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になって、隣接する原子と共に非置換炭素環（但し、R<sup>3</sup>が置換している炭素原子とR<sup>4</sup>が置換している炭素原子間の結合のみが二重結合であり、他の炭素原子間の結合は単結合である）を形成し、かつR<sup>1</sup>が式：-Y

$^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$  (式中、 $Y^1$ 及び $Y^3$ が単結合であり； $Y^2$ が $-O-$ であり； $R^a$ フェニルである)で示される基である場合及び $R^3$ 及び $R^4$ が一緒になって、隣接する原子と共にベンゼン環を形成し、かつ $R^1$ が式： $-Y^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$  (式中、 $Y^1$ が単結合であり、 $Y^3$ がエチレンであり、 $Y^2$ が $-C(=O)-NR^b-$ であり、かつ $R^a$ がスルファモイルで置換されたフェニルである)で示される基である場合を除く。)で示される化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物。

15.  $R^1$ が式： $-Y^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$  (式中、 $Y^1$ 、 $Y^3$ 及び $R^a$ は請求の範囲第14項と同意義であり； $Y^2$ は $-O-$ 、 $-NR^b-C(=O)-$ 又は $-C(=O)-NR^b-$ であり； $R^b$ は水素又は置換されていてもよいアルキルである)で示される基である請求の範囲第14項記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物。

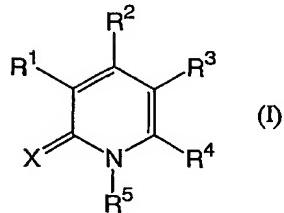
16.  $R^3$ 及び $R^4$ が一緒になつてない請求の範囲第14項又は第15項記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物。

17.  $R^3$ 及び $R^4$ が一緒になつて、隣接する原子と共にヘテロ原子及び/又は不飽和結合が介在していてもよい環を形成する請求の範囲第14項又は第15項記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物。

18.  $R^1$ が式： $-Y^1 - Y^2 - Y^3 - R^a$  (式中、 $Y^1$ は単結合であり； $Y^3$ は置換されていてもよいアルキレンであり； $Y^2$ は $-O-$ 、 $-NH-C(=O)-$ 又は $-C(=O)-NH-$ であり； $R^a$ は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である)で示される基であり； $R^2$ が水素であり； $R^3$ がアルキル、ハロゲン又は式： $-Y^5 - R^d$  (式中、 $Y^5$ は単結合であり； $R^d$ は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である)で示される基であり； $R^4$ が水素又はアルキルであり； $R^5$ が置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式： $-Y^6 - R^e$  (式中、 $Y^6$ は置換されていてもよいアルキレンであり； $R^e$ は置換されていてもよいアリール、置換されてい

てもよいシクロアルキル又は置換されていてもよいヘテロアリールである)で示される基であり;  
又はR<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子が介在していてもよい環を形成していてもよい請求の範囲第14項記載の化合物、そのプロドラ  
5 ッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物。

## 19. 式(I):

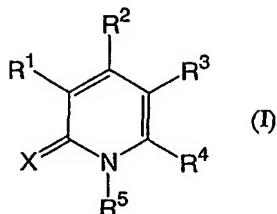


(式中、R<sup>1</sup>は式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>は単結合であり；Y<sup>3</sup>は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり；Y<sup>2</sup>は-C(=O)-NR<sup>b</sup>-  
10 であり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基であり；R<sup>b</sup>は水素である）で示される基であり；R<sup>2</sup>は水素であり；R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は一緒になって、隣接する原子と共に非置換炭素環（但し、R<sup>3</sup>が置換している炭素原子とR<sup>4</sup>が置換している炭素原子間の結合のみが二重結合であり、他の炭素原子間の結合は単結合である）を形成し；R<sup>5</sup>は炭素数3以上のアルキル又是  
15 式：-Y<sup>6</sup>-R<sup>e</sup>（式中、Y<sup>6</sup>は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>e</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル又は置換されていてもよいヘテロアリールである）で示される基であり；XはS又はOである。)で示される化合物のライブラー。

20. 請求の範囲第19項記載の化合物（但し、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になつて、隣接する原子と共に6員の炭素環（但し、R<sup>3</sup>が置換している炭素原子とR<sup>4</sup>が置換している炭素原子間の結合のみが二重結合であり、他の炭素原子間の結合は単結合である）を形成し、かつR<sup>1</sup>が式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>及びY<sup>3</sup>が単結合であり；Y<sup>2</sup>が-O-であり；R<sup>a</sup>フェニルである）で示される基である場合を除く。）、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその

溶媒和物。

21. 式 (I) :

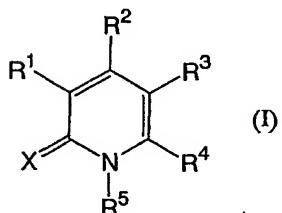


(式中、R<sup>1</sup>は式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>は単結合であり；Y<sup>2</sup>は-5C（=O）-NR<sup>b</sup>-であり；Y<sup>3</sup>は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基であり；R<sup>b</sup>は水素である）で示される基であり；R<sup>2</sup>は水素であり；R<sup>3</sup>は式：-Y<sup>5</sup>-R<sup>d</sup>（式中、Y<sup>5</sup>は単結合、R<sup>d</sup>は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基であり；R<sup>4</sup>は水素又は10アルキルであり；R<sup>5</sup>は炭素数3以上のアルキル又は式：-Y<sup>6</sup>-R<sup>e</sup>（式中、Y<sup>6</sup>は置換されていてもよいアルキレンであり；R<sup>e</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル又は置換されていてもよいヘテロアリールである）で示される基であり；XはS又はOである。）で示される化合物のライ

15 ブラリー。

22. 請求の範囲第21項記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物。

23. 式 (I) :

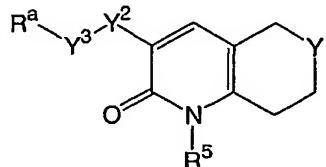


(式中、R<sup>1</sup>は式：-Y<sup>1</sup>-Y<sup>2</sup>-Y<sup>3</sup>-R<sup>a</sup>（式中、Y<sup>1</sup>及びY<sup>3</sup>は単結合であり；Y<sup>2</sup>は-NR<sup>b</sup>-C（=O）-であり；R<sup>a</sup>は置換されていてもよい炭素環式基であり；R<sup>b</sup>は水素である）で示される基であり；R<sup>2</sup>は水素であり；R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>

はそれぞれ独立してアルキルであり；R<sup>5</sup>は炭素数3以上のアルキルで示される基であり；XはOである。)で示される化合物のライブラリー。

24. 請求の範囲第23項記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物。

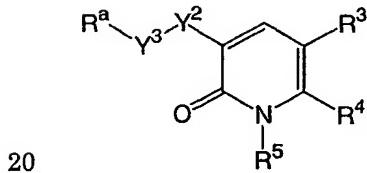
5 25. 式：



(式中、Yは単結合、-NH-、-O-又は-(CH<sub>2</sub>)<sub>1-5</sub>-であり、Y<sup>2</sup>は-C(=O)-NH-又は-NH-C(=O)-であり、Y<sup>3</sup>は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり、R<sup>a</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロサイクルであり、R<sup>5</sup>は置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式：-Y<sup>6</sup>-R<sup>e</sup>（式中、Y<sup>6</sup>はアルキレンであり；R<sup>e</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロサイクルである）で示される基である化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物。

26. Yが-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-である請求の範囲第25項記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物。

27. 式：



(式中、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>はそれぞれ独立してアルキルであり、Y<sup>2</sup>は-C(=O)-NH-又は-NH-C(=O)-であり、Y<sup>3</sup>は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり、R<sup>a</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよい

シクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルケニル、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロサイクルであり、R<sup>5</sup>は置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式：-Y<sup>6</sup>-R<sup>6</sup>（式中、Y<sup>6</sup>はアルキレンであり；R<sup>6</sup>は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロサイクルである）で示される基である化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物。

28. Y<sup>3</sup>が置換されていてもよいアルキレンである請求の範囲第25項～第27項のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩又はその溶媒和物。

29. 請求の範囲第14項～第18項、第20項、第22項、第24～第28項のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有する医薬組成物。

30. カンナビノイド2型受容体親和性である請求の範囲第29項記載の医薬組成物。

31. 抗炎症剤である請求の範囲第29項記載の医薬組成物。  
32. 免疫抑制剤である請求の範囲第29項記載の医薬組成物。  
33. 腎炎治療剤である請求の範囲第29項記載の医薬組成物。  
34. 鎮痛剤である請求の範囲第29項記載の医薬組成物。  
35. 請求の範囲第1項～第13項のいずれかに記載の化合物を投与することを特徴とするカンナビノイド2型受容体に関連する疾患の治療方法。

36. カンナビノイド2型受容体に関連する疾患の治療剤を製造するための請求の範囲第1項～第13項のいずれかに記載の化合物の使用。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/11427

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
(See extra sheet.)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
(See extra sheet.)

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
REGISTRY (STN), CAPLUS (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 887340 A1 (Japan Tobacco Inc.), 30 December, 1998 (30.12.98), Full text & WO 9729079 A1 & US 6017919 A	1-15, 17, 18, 29-34, 36 16, 19-28
X	WO 99/02499 A1 (Japan Tobacco Inc.), 12 January, 1999 (12.01.99), & AU 9881279 A1 Full text	1-15, 17, 18, 29-34, 36 16, 19-28
X	WO 00/69826 A1 (Monsanto Co.), 23 November, 2000 (23.11.00), Full text RN 308134-09-0 1(2H)-Pyridineacetamide, N-[4-[(aminoiminomethyl) amino]-1-(2-thiazolylcarbonyl)butyl]-5- (hydroxymethyl)-2-oxo-3-[(2-phenylethyl)amino]-6- (phenylmethyl)- (Family: none)	1, 2, 4, 6, 9-14, 29-34, 36

 Further documents are listed in the continuation of Box C.  See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"E" earlier document but published on or after the international filing date	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	"&" document member of the same patent family
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search 03 April, 2002 (03.04.02)	Date of mailing of the international search report 16 April, 2002 (16.04.02)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/11427

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>Synthesis and evaluation of 2-pyridinone derivatives as HIV-1-specific reverse transcriptase inhibitors.</p> <p>2. Analogs of 3-aminopyridin-2(1H)-one. SAARI, W.S.; WAI, J.S.; FISHER, T.E.; THOMAS, C.M.; HOFFMAN, J.M.; ROONEY, C.S.; SMITH, A.M.; JONES, J.H.; BAMBERGER, D.L.; et al. <i>J. Med. Chem.</i>, 1992, Vol.35, No.21, pages 3792 to 3802</p> <p>Full text RN 143708-20-7 2(1H)-Pyridinone, 5-ethyl-1, 6-dimethyl-3-[ (2-naphthalenylmethyl)amino]-</p>	1, 4, 6, 7, 14, 16, 29, 30
X	<p>Formation of Dihydropyridone- and Pyridone-Based Peptide Analogs through Aza-Annulation of. beta.-Enamino Ester and Amide Substrates with. alpha.-Amido Acrylate Derivatives.</p> <p>BEHOLZ, L.G.; BENOVSKY, P.; WARD, D.L.; BARTHA, N.S.; STILLE, J.R.</p> <p><i>J. Org. Chem.</i>, 1997, Vol.62, No.4, pages 1033 to 1042</p> <p>Full text</p>	14, 16
X	<p>Studies on amino acid derivatives. IV. Synthesis of 3-amino-2(1H)-pyridone derivatives using 4-ethoxymethylene-2-phenyl-5-oxazolone.</p> <p>CHIBA, T.; TAKAHASHI, T.</p> <p><i>Chem. Pharm. Bull.</i>, 1985, Vol.33, No.7, pages 2731 to 2734</p> <p>RN 103910-17-4 3-Pyridinecarboxylic acid, 5-(benzoylamino)-1, 6-dihydro-2-methyl-6-oxo-1-(phenylmethyl)-, ethyl ester RN 103910-20-9 3-Pyridinecarboxamide, 5-(benzoylamino)-1, 6-dihydro-2-methyl-6-oxo-1-(phenylmethyl)-</p>	14, 16

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/JP01/11427

**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1.  Claims Nos.: 35

because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

Claim 35 falls under the category of methods for treatment of the human body by therapy, that category being provided for in Rule 39.1(iv) of the Regulations under the PCT as a subject matter of international applications which requires no international search.

2.  Claims Nos.:

because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3.  Claims Nos.:

because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

(See extra sheet)

1.  As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.

2.  As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.

3.  As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4.  No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

(See extra sheet)

Remark on Protest  The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

No protest accompanied the payment of additional search fees.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/JP01/11427

**Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
(International Patent Classification (IPC))

Int.Cl<sup>7</sup> C07D213/82, 215/54, 221/04, 401/04, 12, 405/04, 409/04,  
413/06, 12, 14, 417/12, 455/02, 06, 471/04, 491/052,  
A61K31/4439, 4709, 473, 465, 4375, 435, 4545, 5377, 4725,  
506, 496, 4433, 4436, A61P43/00, 25/00, 04, 37/00, 29/00  
(According to International Patent Classification (IPC) or to both  
national classification and IPC)

**Continuation of B. FIELDS SEARCHED**

Minimum Documentation Searched(International Patent Classification (IPC))

Int.Cl<sup>7</sup> C07D213/00-82, 215/00-54, 221/00-04, 401/00-12, 405/00-04,  
409/00-04, 413/00-14, 417/00-12, 455/00-06, 471/00-04,  
491/00-052, A61K31/00-5377

Minimum documentation searched (classification system followed by  
classification symbols)

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/JP01/11427

Continuation of Box No.II of continuation of first sheet(1)

This international application relates to a medicinal composition with a cannabinoid 2-type receptor affinity which contains as the active ingredient a compound having a pyridone moiety and to the pyridone derivative compound.

Medicinal compositions with a cannabinoid 2-type receptor affinity which contain as the active ingredient a compound having a pyridone moiety were already disclosed in documents, i.e., EP 887340 A1 and WO 99/02499 A1, published before the priority date for this international application. In claim 1 and other claims of this application, the term "exclude" is used for the active ingredient to exclude the active-ingredient compounds disclosed in those documents.

Although the active-ingredient compounds disclosed in those documents have been excluded from the claims, the points which remain unchanged are that the only technical feature common to the subject matters of the claims is to use a compound having a pyridone moiety as the active ingredient of a medicinal composition with a cannabinoid 2-type receptor affinity and that this technical feature is not novel. Consequently, this technical feature cannot be regarded as a special technical feature provided for in Rule 13.2 of the Regulations under the PCT in view of the prior art techniques. In the current claims, a subject matter having a special technical feature cannot be recognized until a specific combination of substituents in the active ingredient represented by the formula (I) is specified.

In order to specify a combination of substituents in the active ingredient represented by the formula (I), the choices with respect to each of R1, R2, R3, R4, and R5 are first classified into groups based on substituent similarity.

Five groups of choices for R1:

- 1) hydrogen,
- 2) halogeno,
- 3) cyano, formyl, acyl, carboxy, alkoxy carbonyl, optionally substituted carbamoyl, and isothiocyanato,
- 4) optionally substituted amino, hydroxy, alkoxy, alkylthio, alkenyloxy, alkynyoxy, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, and nitro, and
- 5) -Y1-Y2-Y3-Ra.

Six groups of choices for R2:

- 1) hydrogen,
- 2) optionally substituted alkyl, optionally substituted alkenyl, and optionally substituted alkynyl,
- 3) halogeno,
- 4) cyano, formyl, acyl, carboxy, alkoxy carbonyl, optionally substituted carbamoyl, and isothiocyanato,
- 5) optionally substituted amino, hydroxy, alkoxy, alkylthio, alkenyloxy, alkynyoxy, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, and nitro, and
- 6) -Y4-Rc.

Six groups of choices for R3:

- 1) hydrogen,
- 2) optionally substituted alkyl, optionally substituted alkenyl, and optionally substituted alkynyl,
- 3) halogeno,

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/11427

Continuation of Box No.II of continuation of first sheet(1)

4) cyano, formyl, acyl, carboxy, alkoxy carbonyl, optionally substituted carbamoyl, isothiocyanato, and nitro,

5) optionally substituted amino, hydroxy, alkoxy, alkylthio, alkenyloxy, alkynyoxy, alkylsulfinyl, and alkylsulfonyl, and

6) -Y5-Rd.

Five groups of choices for R4:

1) hydrogen,

2) optionally substituted alkyl, optionally substituted alkenyl, and optionally substituted alkynyl,

3) halogeno,

4) cyano, formyl, acyl, carboxy, alkoxy carbonyl, optionally substituted carbamoyl, and isothiocyanato,

5) optionally substituted amino, hydroxy, alkoxy, alkylthio, alkenyloxy, alkynyoxy, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, and nitro, and

6) -Y5-Rd.

Three groups of choices for R5:

1) hydrogen,

2) carbocyclic or heterocyclic group optionally having one or more heteroatoms and/or unsaturated bonds in the ring structure, and

3) -Y6-Re.

The claims disclose inventions containing as the active ingredient a compound specified based on a combination of choices out of the respective groups. Namely, the number of medicinal compositions disclosed in the claims is regarded as equal to the product of the numbers of the groups of choices for R1, R2, R3, R4, and R5, i.e.,  $5 \times 6 \times 6 \times 6 \times 3 = 3,240$ .

(The invention relating to the compound and those subject matters in which R1 is -Y1-Y2-Y3-Ra comply with the requirement of unity of invention.)

Continuation of Box No.II-4 of continuation of first sheet (1)

An international search for this international application was made with respect to, among those subject matters, compounds corresponding to the compound 1-001 described in the description, wherein

(1) R1 is selected among optionally substituted amino, hydroxy, alkoxy, alkylthio, alkenyloxy, alkynyoxy, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, and nitro,

R2 is hydrogen, and

R3, R4, and R5 each is optionally substituted alkyl.

## 国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP01/11427

## A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））

Int. Cl. 7 C07D213/82, 215/54, 221/04, 401/04, 12, 405/04, 409/04, 413/06, 12, 14, 417/12, 455/02, 06, 471/04, 491/052, A61K31/4439, 4709, 473, 465, 4375, 435, 4545, 5377, 4725, 506, 496, 4433, 4436, A61P43/00, 25/00, 04, 37/00, 29/00

## B. 調査を行った分野

## 調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））

Int. Cl. 7 C07D213/00-82, 215/00-54, 221/00-04, 401/00-12, 405/00-04, 409/00-04, 413/00-14, 417/00-12, 455/00-06, 471/00-04, 491/00-052, A61K31/00-5377

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）  
REGISTRY(STN), CAPLUS(STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	EP 887340 A1 (JAPAN TOBACCO INC.) 30.12月. 1998 (30.12.98) 全文献を参照。	1-15; 17, 18, 29-34, 36
A	& WO 9729079 A1 & US 6017919 A	16, 19-28
X	WO 99/02499 A1 (JAPAN TOBACCO INC.) 12.1月. 1999 (12.01.99) & AU 9881279 A1 全文献を参照。	1-15, 17, 18, 29-34, 36
A		16, 19-28

 C欄の続きにも文献が列挙されている。 パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

03.04.02

国際調査報告の発送日

16.04.02

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官（権限のある職員）

齋藤 恵

印

4 P 9164

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

C(続き)	関連すると認められる文献	関連する 請求の範囲の番号
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	
X	<p>WO 00/69826 A1 (MONSANTO COMPANY) 23.11月.00 (23.11.00)            全文献を参照。            RN 308134-09-0            1(2H)-Pyridineacetamide, N-[4-[(aminoiminomethyl)amino]-1-(2-thiazolylcarbonyl)butyl]-5-(hydroxymethyl)-2-oxo-3-[(2-phenylethyl)amino]-6-(phenylmethyl)-              (ファミリーなし)</p> <p>Synthesis and evaluation of 2-pyridinone derivatives as HIV-1-specific reverse transcriptase inhibitors. 2.            Analogs of 3-aminopyridin-2(1H)-one.            SAARI, W.S. ; WAI, J.S. ; FISHER, T.E. ; THOMAS, C.M. ;            HOFFMAN, J.M. ; ROONEY, C.S. ; SMITH, A.M. ; JONES, J.H. ;            BAMBERGER, D.L. ; et al.            J. Med. Chem., 1992, Vol. 35, No. 21, p. 3792-3802            全文献を参照。            RN 143708-20-7            2(1H)-Pyridinone, 5-ethyl-1,6-dimethyl-3-[(2-naphthalenylmethyl)amino]-</p> <p>Formation of Dihydropyridone- and Pyridone-Based Peptide Analogs through Aza-Annulation of .beta.-EnaminoEster and Amide Substrates with .alpha.-Amido Acrylate Derivatives.            BEHOLZ, L.G. ; BENOVSKY, P. ; WARD, D.L. ; BARTA, N.S. ;            STILLE, J.R.            J. Org. Chem., 1997, Vol. 62, No. 4, p. 1033-1042            全文献を参照。</p> <p>Studies on amino acid derivatives. IV.            Synthesis of 3-amino-2(1H)-pyridone derivatives using 4-ethoxymethylene-2-phenyl-5-oxazolone.            CHIBA, T. ; TAKAHASHI, T.            Chem. Pharm. Bull., 1985, Vol. 33, No. 7, p. 2731-2734              RN 103910-17-4            3-Pyridinecarboxylic acid, 5-(benzoylamino)-1,6-dihydro-2-methyl-6-oxo-1-(phenylmethyl)-, ethyl ester            RN 103910-20-9            3-Pyridinecarboxamide, 5-(benzoylamino)-1,6-dihydro-2-methyl-6-oxo-1-(phenylmethyl)-</p>	1, 2, 4, 6, 9-14, 29-34, 36  1, 4, 6, 7, 14, 16, 29, 30  14, 16  14, 16

## 第I欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見（第1ページの2の続き）

法第8条第3項（PCT第17条(2)(a)）の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1.  請求の範囲 35 は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。つまり、国際調査をすることを要しない国際出願の対象としてPCT規則39.1(iv)に規定された治療による人体の処置方法に該当する。
2.  請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3.  請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

## 第II欄 発明の単一性が欠如しているときの意見（第1ページの3の続き）

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。

（別紙を参照。）

1.  出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2.  追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3.  出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4.  出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

（別紙を参照。）

## 追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。  
 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。

## &lt;第II欄の続き&gt;

本国際出願は、ピリドン部分構造を有する化合物を有効成分として含有するカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物と、ピリドン誘導体化合物に関するものである。

ピリドン部分構造を有する化合物を有効成分とするカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物は、EP 887340 A1, WO 99/02499 A1に本国際出願の優先日前の文献にすでに記載されている。本願請求の範囲1等においては、有効成分について、「除く」という記載があり、上記文献に記載されたものは除外されている。

しかし、これら文献に記載されたものが請求の範囲から除外されていても、請求の範囲に記載された発明が共有する技術的特徴は、ピリドン部分構造を有する化合物をカンナビノイド2型受容体親和性医薬組成物の有効成分として用いる点にしかない点、および、このような技術的特徴が新規でない点には変わりがない。したがって、当該技術的特徴は、先行技術に照らしてみたときには、PCT規則13.2に規定する特別な技術的特徴とはなり得ず、現段階では、特別な技術的特徴を有する発明は、式(I)で表される有効成分の置換基の特定の組み合わせを特定して初めて認識され得る。

そこで、式(I)で表される有効成分の置換基の組み合わせを特定するために、まず、置換基の類似性により、R1, R2, R3, R4, R5の選択肢をグループ化してみる。

## R1の5つの選択肢群：

- 1) 水素、
- 2) ハロゲン、
- 3) シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてよいカルバモイル、インチオシアナト、
- 4) 置換されていてよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ、
- 5) -Y1-Y2-Y3-Ra

## R2の6つの選択肢群：

- 1) 水素、
- 2) 置換されていてよいアルキル、置換されていてよいアルケニル、置換されていてよいアルキニル、
- 3) ハロゲン、
- 4) シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてよいカルバモイル、インチオシアナト、
- 5) 置換されていてよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ、
- 6) -Y4-Rc

(続きあり)

## R3の6つの選択肢群：

- 1) 水素、
- 2) 置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、
- 3) ハロゲン、
- 4) シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、ニトロ、
- 5) 置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、
- 6) -Y5-Rd

## R4の5つの選択肢群：

- 1) 水素、
- 2) 置換されていてもよいアルキル、  
置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、
- 3) ハロゲン、
- 4) シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、
- 5) 置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ、
- 6) -Y5-Rd

## R5の3つの選択肢群：

- 1) 水素、
- 2) ヘテロ原子及び/又は不飽和結合が介在していてもよい炭素環式基又は複素環式基、
- 3) -Y6-Re

請求の範囲には、上記の選択肢の各群の組み合わせで特定される化合物を有効成分とする発明が記載されている。そうすると、請求の範囲に記載された医薬組成物の発明は、R1、R2、R3、R4、R5のとりうる選択肢群の数の積により、 $5 \times 6 \times 6 \times 6 \times 3 = 3,240$  の発明であると認定される。

(化合物に関する発明は、これらのうち、R1が-Y1-Y2-Y3-Raであるものと单一性を満たしている。)

そして、本国際出願についての国際調査は、上記発明のうち、明細書に記載された化合物1-001に対応する

(1) R1が置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロから選ばれ、

R2が水素、

R3、R4、R5が置換されていてもよいアルキル  
である化合物について行った。